

TRIAZOLE DERIVATIVE AND AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL GERMICIDE COMPRISING THE SAME

Patent Number: JP10036357
Publication date: 1998-02-10
Inventor(s): SASAKI NORIO;; GO ATSUSHI;; SAWAI NOBUMITSU;; MAEDA TAKAKO
Applicant(s): MITSUBISHI KAGAKU KK;; RHONE POULENC AGROCHIM
Requested Patent: ☐ JP10036357
Application Number: JP19960196619 19960725
Priority Number(s):
IPC Classification: C07D249/12; A01N43/653
EC Classification:
Equivalents:

Abstract

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new triazole derivative comprising a new structure having strong germicidal effects.

SOLUTION: This new triazole derivative is represented by formula I J is represented by formula II [A is represented by formula III (R1 and R2 are each H, a (substituted) lower alkyl, etc.; X is a halogen, amino, etc.; (n) is 0-2; (m) is 0-3; G1 is N or CH; G2 is O or NH)], etc., e.g. methyl 2-2-(1-benzyl-1,2,4-triazol-3-yl)thiomethylphenyl-3-methoxyacrylate. The compound represented by formula I is obtained by successively reacting one mol compound represented by formula IV with a compound represented by formula V and a compound represented by the formula A-Y (Y is a halogen atom, an alkylsulfonyloxy or an arylsulfonyloxy) in amounts within the range of 0.5-2mol at a reactional temperature within the range of -80 to +150 deg.C or the boiling point of a solvent for a reactional time within the range of 0.1-24hr. An agricultural and horticultural germicide comprising the compound represented by formula I as an active ingredient is capable of manifesting effective germicidal effects on disease injuries of crops in paddy fields, vegetables, etc., without injuring the crops.

Data supplied from the esp@cenet database - I2

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平10-36357

(43) 公開日 平成10年(1998) 2月10日

(51) Int.Cl. ⁶	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 D 249/12	5 0 9		C 0 7 D 249/12	5 0 9
A 0 1 N 43/653			A 0 1 N 43/653	N

審査請求 未請求 請求項の数 2 O L (全 42 頁)

(21) 出願番号 特願平8-196619

(22) 出願日 平成8年(1996) 7月25日

(71) 出願人 000005968

三菱化学株式会社

東京都千代田区丸の内二丁目5番2号

(71) 出願人 590001935

ローヌ・プーラン・アグロシミ

フランス国、69009-リヨン、ルウ・ピエ

ール・バイゼ、14-20

(72) 発明者 佐々木 則雄

茨城県稲敷郡阿見町中央8-3-1 ロー

ヌ・プーラン油化アグロ株式会社阿見研究

所内

(74) 代理人 弁理士 川口 義雄 (外2名)

最終頁に続く

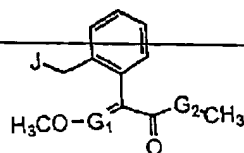
(54) 【発明の名称】 トリアゾール誘導体並びにそれを含有する農薬用殺菌剤

(57) 【要約】

【課題】 農園芸分野では、耐性菌などの出現により、強力な殺菌効果を有する新規な化合物が望まれている。

【解決手段】

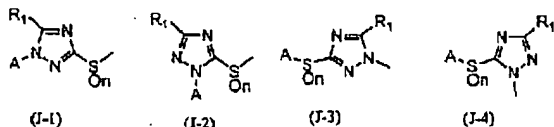
【化1】



(I)

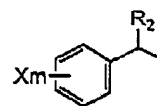
【式中、Jは、下記式(J-1)、(J-2)、(J-3)又は(J-4)であり、

【化2】



Aは、下記式(II)であり、

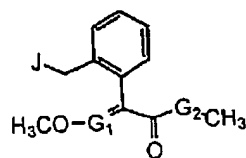
【化3】



(II)

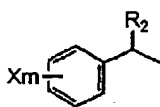
R₁、R₂、X、n、m、G₁、G₂は前記の通りである。】で表わされる新規トリアゾール誘導体。

【化1】

R1N1C(S(=O)(=O)N)C=N1AR1c1nc(s1)N(*)*S(=O)(=O)c1nc(R)n(*)c1Rc1nn(s1)S(=O)(=O)A

(J-4)

【化3】



(11)

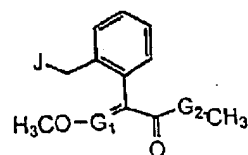
R₁ は、水素原子、(置換されていてもよい)低級アルキル基、(置換されていてもよい)低級アルケニル基、(置換されていてもよい)低級アルキニル基、(置換されていてもよい)低級シクロアルキル基又は(置換されていてもよい)フェニル基を示し、R₂ は、水素原子、(置換されていてもよい)低級アルキル基、(置換されていてもよい)低級アルコキシ基又は(置換されていてもよい)低級シクロアルキル基を示し、Xは、ハロゲン原子、シアノ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、低級シクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルフェニル基、低級アルキルスルホニル基、低級ハロアルコキシカルボニル基、低級ハロ

【化2】

アルキル基、低級ハロアルケニル基、低級ハロアルキニル基、低級ハロシクロアルキル基、低級ハロアルコキシ基、低級ハロアルキルチオ基、低級ハロアルキルスルフェニル基、又は低級ハロアルキルスルホニル基を示し、 n は、0、1、又は2を示し、 m は、0、1、2、又は3を示し、 G_1 は、窒素原子又は基CHを示し、 G_2 は、酸素原子又は基NHを示す。]で表わされるトリアゾール誘導体。

【請求項2】 一般式（I）

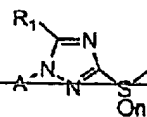
【化4】



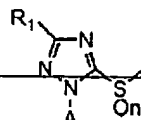
(I)

[式中Jは、下記式、(J-1)、(J-2)、(J-3)又は(J-4)であり、

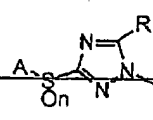
【化5】



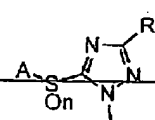
(J-1)



(J-2)

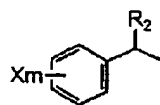


(J-3)



(J-4)

【化6】



(I)

R₁ は、水素原子、(置換されていてもよい)低級アルキル基、(置換されていてもよい)低級アルケニル基、(置換されていてもよい)低級アルキニル基、(置換されていてもよい)低級シクロアルキル基又は(置換され

ていてもよい)フェニル基を示し、 R_2 は、水素原子、(置換されていてもよい)低級アルキル基、(置換されていてもよい)低級アルコキシ基又は(置換されていてもよい)低級シクロアルキル基を示し、Xは、ハロゲン原子、シアノ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、低級シクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルフェニル基、低級アルキルスルホニル基、低級ハロアルコキシカルボニル基、低級ハロアルキル基、低級ハロアルケニル基、低級ハロアルキニ

ル基、低級ハロシクロアルキル基、低級ハロアルコキシ基、低級ハロアルキルチオ基、低級ハロアルキルスルフェニル基、又は低級ハロアルキルスルホニル基を示し、 n は、0、1、又は2を示し、 m は、0、1、2、又は3を示し、 G_1 は、窒素原子又は基CHを示し、 G_2 は、酸素原子又は基NHを示す。]で表わされるトリアゾール誘導体を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺菌剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、文献未記載の新規なトリアゾール誘導体、並びにそれを含有する農園芸用殺菌剤に関するものである。

【0002】

【従来の技術】日本特許公開平3-206075号公報には、殺菌活性を持つある種のトリアゾール誘導体が開示されているが、トリアゾールに結合した硫黄原子及びトリアゾール環の窒素原子上に2個のベンジル誘導体を置換基として有し、かつ、少なくともその一方は2位に酢酸誘導体残基を有する化合物は開示されていない。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】農園芸用殺菌剤としてこれまでに多くの化合物が発明され使用されているが、同じ薬剤を多年連用することにより、薬剤に対する耐性を獲得した菌の出現などで殺菌効果が低下するなどの問題が生じている。従って農園芸用殺菌剤に関しては、強力な殺菌効果を有する新しい構造からなる化合物の創製

が期待されている。

【0004】本発明は、これらの要望を満たした新規な農園芸用殺菌剤を提供しようとするものである。

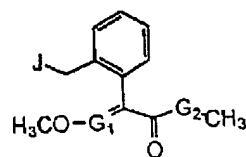
【0005】

【課題を解決するための手段】上記課題を解決するために、本発明者らは、鋭意研究を行った結果、ある種のトリアゾール誘導体が、優れた殺菌活性を有することを見出し、本発明を完成するに至った。

【0006】本発明の新規なメルカプトトリアゾール誘導体は、下記一般式(I)で表わされるものである。なお、本発明におけるトリアゾール誘導体は、二重結合に関してsyn,anti(又はcis,trans)の立体異性体が存在するが、本発明は、それらの混合物及び純粋な異性体のいずれをも包含するものである。

【0007】

【化7】

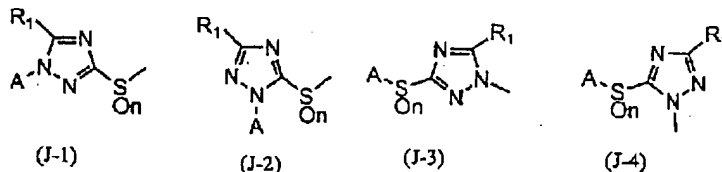


(I)

【0008】[式中Jは、下記式、(J-1)、(J-2)、(J-3)又は(J-4)であり、

【0009】

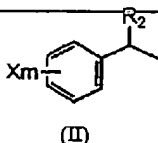
【化8】



【0010】Aは、下記式、(II)であり、

【0011】

【化9】



(II)

【0012】 R_1 は、水素原子、(置換されていてもよい)低級アルキル基、(置換されていてもよい)低級アルケニル基、(置換されていてもよい)低級アルキニル基、(置換されていてもよい)低級シクロアルキル基又は(置換されていてもよい)フェニル基を示し、 R_2 は、水素原子、(置換されていてもよい)低級アルキル基、(置換されていてもよい)低級アルコキシ基又は(置換されていてもよい)低級シクロアルキル基を示し、Xは、ハロゲン原子、シアノ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級

アルキニル基、低級シクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルフェニル基、低級アルキルスルホニル基、低級ハロアルコキシカルボニル基、低級ハロアルキル基、低級ハロアルケニル基、低級ハロアルキニル基、低級ハロシクロアルキル基、低級ハロアルコキシ基、低級ハロアルキルチオ基、低級ハロアルキルスルフェニル基、又は低級ハロアルキルスルホニル基を示し、 n は、0、1、又は2を示し、 m は、0、1、2、又は3を示し、 G_1 は、窒素原子又は基CHを示し、 G_2 は、酸素原子又は基NHを示す。]で表わされるトリアゾール誘導体。

【0013】次に本発明の前記一般式(I)で表わされるトリアゾール誘導体について詳細に説明する。

【0014】本発明の、(置換されていてもよい)低級アルキル基、(置換されていてもよい)低級アルケニル基、(置換されていてもよい)低級アルキニル基、(置換されていてもよい)低級アルコキシ基及び(置換され

ていてもよい) 低級シクロアルキル基の(置換されていてもよい)置換基とは、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコキシカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフェニル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル基、(置換されていてもよい)フェニル基、(置換されていてもよい)フェノキシ基、(置換されていてもよい)フェニルチオ基、(置換されていてもよい)ヘテロアリール基、(置換されていてもよい)ヘテロアリールオキシ基及び(置換されていてもよい)ヘテロアリールチオ基を示す。また(置換されていてもよい)フェニル基、(置換されていてもよい)ヘテロアリール基、(置換されていてもよい)フェノキシ基、(置換されていてもよい)フェニルチオ基、(置換されていてもよい)ヘテロアリールオキシ基及び(置換されていてもよい)ヘテロアリールチオ基の(置換されていてもよい)置換基とは、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコキシカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフェニル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル基を示す。

【0015】本発明の前記一般式(I)における R_1 、 R_2 、 R_3 およびXの定義中の基の具体例を以下に説明する。

【0016】ハロゲン原子；フッ素、塩素、臭素又はヨウ素原子を示す。

【0017】低級アルキル基；例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、ネオペンチル、*tert*-ペンチル、ヘキシル基等の如き炭素数1~6の直鎖または分岐した低級アルキル基を挙げることができる。

【0018】低級アルケニル基；例えば、エテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル基等の如き炭素数2~6の直鎖または分岐した低級アルケニル基を挙げることができる。

【0019】低級アルキニル基；例えば、エチニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル基等の如き炭素数2~6の直鎖または分岐した低級アルキニル基を挙げることができる。

【0020】低級シクロアルキル基；例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロペンテニル、シクロヘキシニル基等の如き炭素数3~6の飽和または不飽和の低級シクロアルキル基を挙げることができる。

【0021】低級アルコキシ基；例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、ペントキシ基等の如き、前記低級アルキル基をアルキル部分として含む低級アルコキシ基を挙げることができる。

【0022】低級アルキルチオ基；例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオ基等の如き、前記低級アルキル基をアルキル部分として含む低級アルキルチオ基を挙げることができる。

【0023】低級アルキルスルフェニル基；例えばメチルスルフェニル、エチルスルフェニル、プロピルスルフェニル、イソプロピルスルフェニル、ブチルスルフェニル、ペンチルスルフェニル基等の如き、前記低級アルキル基をアルキル部分として含む低級アルキルスルフェニル基を挙げることができる。

【0024】低級アルキルスルホニル基；例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、ブチルスルホニル、ペンチルスルホニル基等の如き、前記低級アルキル基をアルキル部分として含む低級アルキルスルホニル基を挙げることができる。

【0025】低級ハロアルキル基；例えば、プロモメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、1-クロロエチル、2-ヨードエチル、3-クロロプロピル、2-メチル-2-クロロプロピル、2,2,2-トリフルオロエチル基等の如き、炭素数1~6の低級ハロアルキル基を挙げることができる。

【0026】低級ハロアルコキシ基；例えば、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、2-クロロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、3-クロロプロポキシ基等の如き、上記ハロアルキル基をアルキル部分として含む低級ハロアルコキシ基を挙げることができる。

【0027】低級ハロアルキルチオ基；例えば、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、2-クロロエチルチオ、1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ、3-クロロプロピルチオ基等の如き、上記ハロアルキル基をアルキル部分として含む低級ハロアルキルチオ基を挙げることができる。

【0028】低級ハロアルキルスルフェニル基；例えば、トリフルオロメチルスルフェニル、ジフルオロメチ

ルスルフェニル、クロロジフルオロメチルスルフェニル、2-クロロエチルスルフェニル、1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルフェニル、3-クロロプロピルスルフェニル基等の如き、上記ハロアルキル基をアルキル部分として含む低級ハロアルキルスルフェニル基を挙げることができる。

【0029】低級ハロアルキルスルホニル基：例えば、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、2-クロロエチルスルホニル、1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルホニル、3-クロロプロピルスルホニル基等の如き、上記ハロアルキル基をアルキル部分として含む低級ハロアルキルスルホニル基を挙げることができる。

【0030】低級アルコキシカルボニル基：例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル基等の如き炭素数2～7のアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0031】低級ハロアルコキシカルボニル基：例えば、トリフルオロメトキシカルボニル、ジフルオロメトキシカルボニル、クロロジフルオロメトキシカルボニル、2-クロロエトキシカルボニル、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシカルボニル、3-クロロプロポキシカルボニル基等の如き、上記ハロアルキル基をアルキル部分として含む低級ハロアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0032】低級ジアルキルアミノ基：例えば、ジメチルアミノ、エチルメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ基等のとき炭素数1～6のアルキル基2個により置換されたアミノ基を挙げることができる。

【0033】ヘテロアリール基：例えば、フラニル、チ

エニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、ビリジル、ビリミジル、ピリダジニル基のごとき、1～3個のヘテロ原子を含む5又は6員の複素環基を挙げることができる。

【0034】また、上記の基に具体的に示されていない基は、既に挙げた原子及び基から任意に組み合わせて、或いは一般的に知られた常識に従って選択される。

【0035】

【発明の実施の形態】本発明により提供される前記一般式(I)で表わされる本発明の化合物の置換基X_m, R₁, R₂及びnの具体例を表1に示す。なお本記載の表中で用いられている略号の意味は下記の通りである。

【0036】Me；メチル基

Et；エチル基

n-Pr；n-プロピル基

iso-Pr；イソプロピル基

c-Pr；シクロプロピル基

n-Bu；n-ブチル基

s-Bu；sec-ブチル基

i-Bu；イソブチル基

t-Bu；tert-ブチル基

c-Bu；シクロブチル基

c-Pen；シクロペンチル基

n-Hex；n-ヘキシル基

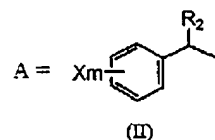
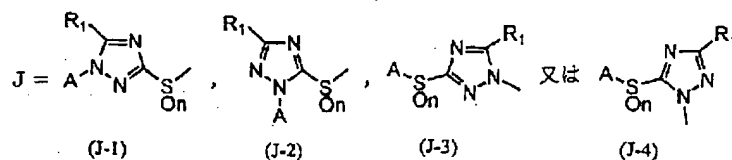
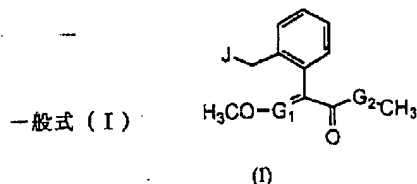
c-Hex；シクロヘキシル基

Ph；フェニル基

Bn；ベンジル基

【0037】

【化10】



【0038】

【表1】

表1

化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.1	H	H	H	0
1.2	H	H	H	1
1.3	H	H	H	2
1.4	H	Me	H	0
1.5	H	Me	H	1
1.6	H	Me	H	2
1.7	H	Et	H	0
1.8	H	Et	H	1
1.9	H	Et	H	2
1.10	H	n-Pr	H	0
1.11	H	n-Pr	H	1
1.12	H	n-Pr	H	2
1.13	H	i-Pr	H	0
1.14	H	i-Pr	H	1
1.15	H	i-Pr	H	2
1.16	H	c-Pr	H	0
1.17	H	c-Pr	H	1
1.18	H	c-Pr	H	2
1.19	H	n-Bu	H	0
1.20	H	n-Bu	H	1
1.21	H	n-Bu	H	2
1.22	H	i-Bu	H	0
1.23	H	i-Bu	H	1
1.24	H	i-Bu	H	2
1.25	H	s-Bu	H	0
1.26	H	s-Bu	H	1
1.27	H	s-Bu	H	2
1.28	H	t-Bu	H	0
1.29	H	t-Bu	H	1
1.30	H	t-Bu	H	2

【0039】

化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.31	H	c-Bu	H	0
1.32	H	c-Bu	H	1
1.33	H	c-Bu	H	2
1.34	H	n-Hex	H	0
1.35	H	n-Hex	H	1
1.36	H	n-Hex	H	2
1.37	H	c-Pen	H	0
1.38	H	c-Pen	H	1
1.39	H	c-Pen	H	2
1.40	H	c-Hex	H	0
1.41	H	c-Hex	H	1
1.42	H	c-Hex	H	2
1.43	H	allyl	H	0
1.44	H	allyl	H	1
1.45	H	allyl	H	2
1.46	H	Ph	H	0
1.47	H	Ph	H	1
1.48	H	Ph	H	2
1.49	H	Bn	H	0
1.50	H	Bn	H	1
1.51	H	Bn	H	2
1.52	H	2-Me-C6H4	H	0
1.53	H	2-Me-C6H4	H	1
1.54	H	2-Me-C6H4	H	2
1.55	H	2-CF3-C6H4	H	0
1.56	H	2-CF3-C6H4	H	1
1.57	H	2-CF3-C6H4	H	2
1.58	H	3-CF3-C6H4	H	0
1.59	H	3-CF3-C6H4	H	1
1.60	H	3-CF3-C6H4	H	2

【表2】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.61	H	H	Me	0
1.62	H	H	Me	1
1.63	H	H	Me	2
1.64	H	Me	Me	0
1.65	H	Me	Me	1
1.66	H	Me	Me	2
1.67	H	Et	Me	0
1.68	H	Et	Me	1
1.69	H	Et	Me	2
1.70	H	n-Pr	Me	0
1.71	H	n-Pr	Me	1
1.72	H	n-Pr	Me	2
1.73	H	i-Pr	Me	0
1.74	H	i-Pr	Me	1
1.75	H	i-Pr	Me	2
1.76	H	o-Pr	Me	0
1.77	H	o-Pr	Me	1
1.78	H	o-Pr	Me	2
1.79	H	n-Bu	Me	0
1.80	H	n-Bu	Me	1
1.81	H	n-Bu	Me	2
1.82	H	i-Bu	Me	0
1.83	H	i-Bu	Me	1
1.84	H	i-Bu	Me	2
1.85	H	s-Bu	Me	0
1.86	H	s-Bu	Me	1
1.87	H	s-Bu	Me	2
1.88	H	t-Bu	Me	0
1.89	H	t-Bu	Me	1
1.90	H	t-Bu	Me	2

化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.91	H	CF3	Me	0
1.92	H	CF3	Me	1
1.93	H	CF3	Me	2
1.94	H	n-Hex	Me	0
1.95	H	n-Hex	Me	1
1.96	H	n-Hex	Me	2
1.97	H	o-Pen	Me	0
1.98	H	o-Pen	Me	1
1.99	H	o-Pen	Me	2
1.100	H	o-Hex	Me	0
1.101	H	o-Hex	Me	1
1.102	H	o-Hex	Me	2
1.103	H	allyl	Me	0
1.104	H	allyl	Me	1
1.105	H	allyl	Me	2
1.106	H	Ph	Me	0
1.107	H	Ph	Me	1
1.108	H	Ph	Me	2
1.109	H	Bn	Me	0
1.110	H	Bn	Me	1
1.111	H	Bn	Me	2
1.112	H	2-Me-C6H4	Me	0
1.113	H	2-Me-C6H4	Me	1
1.114	H	2-Me-C6H4	Me	2
1.115	H	2-CF3-C6H4	Me	0
1.116	H	2-CF3-C6H4	Me	1
1.117	H	2-CF3-C6H4	Me	2
1.118	H	3-CF3-C6H4	Me	0
1.119	H	3-CF3-C6H4	Me	1
1.120	H	3-CF3-C6H4	Me	2

【0040】

【表3】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.121	H	H	Et	0
1.122	H	H	Et	1
1.123	H	H	Et	2
1.124	H	Me	Et	0
1.125	H	Me	Et	1
1.126	H	Me	Et	2
1.127	H	Et	Et	0
1.128	H	Et	Et	1
1.129	H	Et	Et	2
1.130	H	n-Pr	Et	0
1.131	H	n-Pr	Et	1
1.132	H	n-Pr	Et	2
1.133	H	i-Pr	Et	0
1.134	H	i-Pr	Et	1
1.135	H	i-Pr	Et	2
1.136	H	c-Pr	Et	0
1.137	H	c-Pr	Et	1
1.138	H	c-Pr	Et	2
1.139	H	n-Bu	Et	0
1.140	H	n-Bu	Et	1
1.141	H	n-Bu	Et	2
1.142	H	i-Bu	Et	0
1.143	H	i-Bu	Et	1
1.144	H	i-Bu	Et	2
1.145	H	s-Bu	Et	0
1.146	H	s-Bu	Et	1
1.147	H	s-Bu	Et	2
1.148	H	t-Bu	Et	0
1.149	H	t-Bu	Et	1
1.150	H	t-Bu	Et	2

化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.151	H	c-Bu	Et	0
1.152	H	c-Bu	Et	1
1.153	H	c-Bu	Et	2
1.154	H	n-Hex	Et	0
1.155	H	n-Hex	Et	1
1.156	H	n-Hex	Et	2
1.157	H	c-Pen	Et	0
1.158	H	c-Pen	Et	1
1.159	H	c-Pen	Et	2
1.160	H	c-Hex	Et	0
1.161	H	c-Hex	Et	1
1.162	H	c-Hex	Et	2
1.163	H	allyl	Et	0
1.164	H	allyl	Et	1
1.165	H	allyl	Et	2
1.166	H	Ph	Et	0
1.167	H	Ph	Et	1
1.168	H	Ph	Et	2
1.169	H	Bn	Et	0
1.170	H	Bn	Et	1
1.171	H	Bn	Et	2
1.172	H	2-Me-C6H4	Et	0
1.173	H	2-Me-C6H4	Et	1
1.174	H	2-Me-C6H4	Et	2
1.175	H	2-CF3-C6H4	Et	0
1.176	H	2-CF3-C6H4	Et	1
1.177	H	2-CF3-C6H4	Et	2
1.178	H	3-CF3-C6H4	Et	0
1.179	H	3-CF3-C6H4	Et	1
1.180	H	3-CF3-C6H4	Et	2

【0041】

【表4】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.181	H	H	i-Pr	0	1.211	H	H	c-Pr	0
1.182	H	H	i-Pr	1	1.212	H	H	c-Pr	1
1.183	H	H	i-Pr	2	1.213	H	H	c-Pr	2
1.184	H	Me	i-Pr	0	1.214	H	Me	c-Pr	0
1.185	H	Me	i-Pr	1	1.215	H	Me	c-Pr	1
1.186	H	Me	i-Pr	2	1.216	H	Me	c-Pr	2
1.187	H	Et	i-Pr	0	1.217	H	Et	c-Pr	0
1.188	H	Et	i-Pr	1	1.218	H	Et	c-Pr	1
1.189	H	Et	i-Pr	2	1.219	H	Et	c-Pr	2
1.190	H	n-Pr	i-Pr	0	1.220	H	n-Pr	c-Pr	0
1.191	H	n-Pr	i-Pr	1	1.221	H	n-Pr	c-Pr	1
1.192	H	n-Pr	i-Pr	2	1.222	H	n-Pr	c-Pr	2
1.193	H	i-Pr	i-Pr	0	1.223	H	i-Pr	c-Pr	0
1.194	H	i-Pr	i-Pr	1	1.224	H	i-Pr	c-Pr	1
1.195	H	i-Pr	i-Pr	2	1.225	H	i-Pr	c-Pr	2
1.196	H	c-Pr	i-Pr	0	1.226	H	c-Pr	c-Pr	0
1.197	H	c-Pr	i-Pr	1	1.227	H	c-Pr	c-Pr	1
1.198	H	c-Pr	i-Pr	2	1.228	H	c-Pr	c-Pr	2
1.199	H	n-Bu	i-Pr	0	1.229	H	n-Bu	c-Pr	0
1.200	H	n-Bu	i-Pr	1	1.230	H	n-Bu	c-Pr	1
1.201	H	n-Bu	i-Pr	2	1.231	H	n-Bu	c-Pr	2
1.202	H	i-Bu	i-Pr	0	1.232	H	i-Bu	c-Pr	0
1.203	H	i-Bu	i-Pr	1	1.233	H	i-Bu	c-Pr	1
1.204	H	i-Bu	i-Pr	2	1.234	H	i-Bu	c-Pr	2
1.205	H	s-Bu	i-Pr	0	1.235	H	s-Bu	c-Pr	0
1.206	H	s-Bu	i-Pr	1	1.236	H	s-Bu	c-Pr	1
1.207	H	s-Bu	i-Pr	2	1.237	H	s-Bu	c-Pr	2
1.208	H	t-Bu	i-Pr	0	1.238	H	t-Bu	c-Pr	0
1.209	H	t-Bu	i-Pr	1	1.239	H	t-Bu	c-Pr	1
1.210	H	t-Bu	i-Pr	2	1.240	H	t-Bu	c-Pr	2

【0042】

【表5】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.241	H	H	CF3	0	1.271	H	H	n-Pr	0
1.242	H	H	CF3	1	1.272	H	H	n-Pr	1
1.243	H	H	CF3	2	1.273	H	H	n-Pr	2
1.244	H	Me	CF3	0	1.274	H	Me	n-Pr	0
1.245	H	Me	CF3	1	1.275	H	Me	n-Pr	1
1.246	H	Me	CF3	2	1.276	H	Me	n-Pr	2
1.247	H	Et	CF3	0	1.277	H	Et	n-Pr	0
1.248	H	Et	CF3	1	1.278	H	Et	n-Pr	1
1.249	H	Et	CF3	2	1.279	H	Et	n-Pr	2
1.250	H	n-Pr	CF3	0	1.280	H	n-Pr	n-Pr	0
1.251	H	n-Pr	CF3	1	1.281	H	n-Pr	n-Pr	1
1.252	H	n-Pr	CF3	2	1.282	H	n-Pr	n-Pr	2
1.253	H	i-Pr	CF3	0	1.283	H	i-Pr	n-Pr	0
1.254	H	i-Pr	CF3	1	1.284	H	i-Pr	n-Pr	1
1.255	H	i-Pr	CF3	2	1.285	H	i-Pr	n-Pr	2
1.256	H	c-Pr	CF3	0	1.286	H	c-Pr	n-Pr	0
1.257	H	c-Pr	CF3	1	1.287	H	c-Pr	n-Pr	1
1.258	H	c-Pr	CF3	2	1.288	H	c-Pr	n-Pr	2
1.259	H	n-Bu	CF3	0	1.289	H	n-Bu	n-Pr	0
1.260	H	n-Bu	CF3	1	1.290	H	n-Bu	n-Pr	1
1.261	H	n-Bu	CF3	2	1.291	H	n-Bu	n-Pr	2
1.262	H	i-Bu	CF3	0	1.292	H	i-Bu	n-Pr	0
1.263	H	i-Bu	CF3	1	1.293	H	i-Bu	n-Pr	1
1.264	H	i-Bu	CF3	2	1.294	H	i-Bu	n-Pr	2
1.265	H	s-Bu	CF3	0	1.295	H	s-Bu	n-Pr	0
1.266	H	s-Bu	CF3	1	1.296	H	s-Bu	n-Pr	1
1.267	H	s-Bu	CF3	2	1.297	H	s-Bu	n-Pr	2
1.268	H	t-Bu	CF3	0	1.298	H	t-Bu	n-Pr	0
1.269	H	t-Bu	CF3	1	1.299	H	t-Bu	n-Pr	1
1.270	H	t-Bu	CF3	2	1.300	H	t-Bu	n-Pr	2

【0043】

【表6】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.301	2-Me	H	H	0	1.331	2-Me	H	Me	0
1.302	2-Me	H	H	1	1.332	2-Me	H	Me	1
1.303	2-Me	H	H	2	1.333	2-Me	H	Me	2
1.304	2-Me	Me	H	0	1.334	2-Me	Me	Me	0
1.305	2-Me	Me	H	1	1.335	2-Me	Me	Me	1
1.306	2-Me	Me	H	2	1.336	2-Me	Me	Me	2
1.307	2-Me	Et	H	0	1.337	2-Me	Et	Me	0
1.308	2-Me	Et	H	1	1.338	2-Me	Et	Me	1
1.309	2-Me	Et	H	2	1.339	2-Me	Et	Me	2
1.310	2-Me	n-Pr	H	0	1.340	2-Me	n-Pr	Me	0
1.311	2-Me	n-Pr	H	1	1.341	2-Me	n-Pr	Me	1
1.312	2-Me	n-Pr	H	2	1.342	2-Me	n-Pr	Me	2
1.313	2-Me	i-Pr	H	0	1.343	2-Me	i-Pr	Me	0
1.314	2-Me	i-Pr	H	1	1.344	2-Me	i-Pr	Me	1
1.315	2-Me	i-Pr	H	2	1.345	2-Me	i-Pr	Me	2
1.316	2-Me	c-Pr	H	0	1.346	2-Me	c-Pr	Me	0
1.317	2-Me	c-Pr	H	1	1.347	2-Me	c-Pr	Me	1
1.318	2-Me	c-Pr	H	2	1.348	2-Me	c-Pr	Me	2
1.319	2-Me	n-Bu	H	0	1.349	2-Me	n-Bu	Me	0
1.320	2-Me	n-Bu	H	1	1.350	2-Me	n-Bu	Me	1
1.321	2-Me	n-Bu	H	2	1.351	2-Me	n-Bu	Me	2
1.322	2-Me	i-Bu	H	0	1.352	2-Me	i-Bu	Me	0
1.323	2-Me	i-Bu	H	1	1.353	2-Me	i-Bu	Me	1
1.324	2-Me	i-Bu	H	2	1.354	2-Me	i-Bu	Me	2
1.325	2-Me	s-Bu	H	0	1.355	2-Me	s-Bu	Me	0
1.326	2-Me	s-Bu	H	1	1.356	2-Me	s-Bu	Me	1
1.327	2-Me	s-Bu	H	2	1.357	2-Me	s-Bu	Me	2
1.328	2-Me	t-Bu	H	0	1.358	2-Me	t-Bu	Me	0
1.329	2-Me	t-Bu	H	1	1.359	2-Me	t-Bu	Me	1
1.330	2-Me	t-Bu	H	2	1.360	2-Me	t-Bu	Me	2

【0044】

【表7】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.361	3-Me	H	H	0	1.391	3-Me	H	Me	0
1.362	3-Me	H	H	1	1.392	3-Me	H	Me	1
1.363	3-Me	H	H	2	1.393	3-Me	H	Me	2
1.364	3-Me	Me	H	0	1.394	3-Me	Me	Me	0
1.365	3-Me	Me	H	1	1.395	3-Me	Me	Me	1
1.366	3-Me	Me	H	2	1.396	3-Me	Me	Me	2
1.367	3-Me	Et	H	0	1.397	3-Me	Et	Me	0
1.368	3-Me	Et	H	1	1.398	3-Me	Et	Me	1
1.369	3-Me	Et	H	2	1.399	3-Me	Et	Me	2
1.370	3-Me	n-Pr	H	0	1.400	3-Me	n-Pr	Me	0
1.371	3-Me	n-Pr	H	1	1.401	3-Me	n-Pr	Me	1
1.372	3-Me	n-Pr	H	2	1.402	3-Me	n-Pr	Me	2
1.373	3-Me	i-Pr	H	0	1.403	3-Me	i-Pr	Me	0
1.374	3-Me	i-Pr	H	1	1.404	3-Me	i-Pr	Me	1
1.375	3-Me	i-Pr	H	2	1.405	3-Me	i-Pr	Me	2
1.376	3-Me	c-Pr	H	0	1.406	3-Me	c-Pr	Me	0
1.377	3-Me	c-Pr	H	1	1.407	3-Me	c-Pr	Me	1
1.378	3-Me	c-Pr	H	2	1.408	3-Me	c-Pr	Me	2
1.379	3-Me	n-Bu	H	0	1.409	3-Me	n-Bu	Me	0
1.380	3-Me	n-Bu	H	1	1.410	3-Me	n-Bu	Me	1
1.381	3-Me	n-Bu	H	2	1.411	3-Me	n-Bu	Me	2
1.382	3-Me	i-Bu	H	0	1.412	3-Me	i-Bu	Me	0
1.383	3-Me	i-Bu	H	1	1.413	3-Me	i-Bu	Me	1
1.384	3-Me	i-Bu	H	2	1.414	3-Me	i-Bu	Me	2
1.385	3-Me	s-Bu	H	0	1.415	3-Me	s-Bu	Me	0
1.386	3-Me	s-Bu	H	1	1.416	3-Me	s-Bu	Me	1
1.387	3-Me	s-Bu	H	2	1.417	3-Me	s-Bu	Me	2
1.388	3-Me	t-Bu	H	0	1.418	3-Me	t-Bu	Me	0
1.389	3-Me	t-Bu	H	1	1.419	3-Me	t-Bu	Me	1
1.390	3-Me	t-Bu	H	2	1.420	3-Me	t-Bu	Me	2

【0045】

【表8】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.421	4-Me	H	H	0	1.451	4-Me	H	Me	0
1.422	4-Me	H	H	1	1.452	4-Me	H	Me	1
1.423	4-Me	H	H	2	1.453	4-Me	H	Me	2
1.424	4-Me	Me	H	0	1.454	4-Me	Me	Me	0
1.425	4-Me	Me	H	1	1.455	4-Me	Me	Me	1
1.426	4-Me	Me	H	2	1.456	4-Me	Me	Me	2
1.427	4-Me	Et	H	0	1.457	4-Me	Et	Me	0
1.428	4-Me	Et	H	1	1.458	4-Me	Et	Me	1
1.429	4-Me	Et	H	2	1.459	4-Me	Et	Me	2
1.430	4-Me	n-Pr	H	0	1.460	4-Me	n-Pr	Me	0
1.431	4-Me	n-Pr	H	1	1.461	4-Me	n-Pr	Me	1
1.432	4-Me	n-Pr	H	2	1.462	4-Me	n-Pr	Me	2
1.433	4-Me	i-Pr	H	0	1.463	4-Me	i-Pr	Me	0
1.434	4-Me	i-Pr	H	1	1.464	4-Me	i-Pr	Me	1
1.435	4-Me	i-Pr	H	2	1.465	4-Me	i-Pr	Me	2
1.436	4-Me	c-Pr	H	0	1.466	4-Me	c-Pr	Me	0
1.437	4-Me	c-Pr	H	1	1.467	4-Me	c-Pr	Me	1
1.438	4-Me	c-Pr	H	2	1.468	4-Me	c-Pr	Me	2
1.439	4-Me	n-Bu	H	0	1.469	4-Me	n-Bu	Me	0
1.440	4-Me	n-Bu	H	1	1.470	4-Me	n-Bu	Me	1
1.441	4-Me	n-Bu	H	2	1.471	4-Me	n-Bu	Me	2
1.442	4-Me	i-Bu	H	0	1.472	4-Me	i-Bu	Me	0
1.443	4-Me	i-Bu	H	1	1.473	4-Me	i-Bu	Me	1
1.444	4-Me	i-Bu	H	2	1.474	4-Me	i-Bu	Me	2
1.445	4-Me	s-Bu	H	0	1.475	4-Me	s-Bu	Me	0
1.446	4-Me	s-Bu	H	1	1.476	4-Me	s-Bu	Me	1
1.447	4-Me	s-Bu	H	2	1.477	4-Me	s-Bu	Me	2
1.448	4-Me	t-Bu	H	0	1.478	4-Me	t-Bu	Me	0
1.449	4-Me	t-Bu	H	1	1.479	4-Me	t-Bu	Me	1
1.450	4-Me	t-Bu	H	2	1.480	4-Me	t-Bu	Me	2

【0046】

【表9】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.481	2-CF3	H	H	0	1.511	2-CF3	H	Me	0
1.482	2-CF3	H	H	1	1.512	2-CF3	H	Me	1
1.483	2-CF3	H	H	2	1.513	2-CF3	H	Me	2
1.484	2-CF3	Me	H	0	1.514	2-CF3	Me	Me	0
1.485	2-CF3	Me	H	1	1.515	2-CF3	Me	Me	1
1.486	2-CF3	Me	H	2	1.516	2-CF3	Me	Me	2
1.487	2-CF3	Et	H	0	1.517	2-CF3	Et	Me	0
1.488	2-CF3	Et	H	1	1.518	2-CF3	Et	Me	1
1.489	2-CF3	Et	H	2	1.519	2-CF3	Et	Me	2
1.490	2-CF3	n-Pr	H	0	1.520	2-CF3	n-Pr	Me	0
1.491	2-CF3	n-Pr	H	1	1.521	2-CF3	n-Pr	Me	1
1.492	2-CF3	n-Pr	H	2	1.522	2-CF3	n-Pr	Me	2
1.493	2-CF3	i-Pr	H	0	1.523	2-CF3	i-Pr	Me	0
1.494	2-CF3	i-Pr	H	1	1.524	2-CF3	i-Pr	Me	1
1.495	2-CF3	i-Pr	H	2	1.525	2-CF3	i-Pr	Me	2
1.496	2-CF3	c-Pr	H	0	1.526	2-CF3	c-Pr	Me	0
1.497	2-CF3	c-Pr	H	1	1.527	2-CF3	c-Pr	Me	1
1.498	2-CF3	c-Pr	H	2	1.528	2-CF3	c-Pr	Me	2
1.499	2-CF3	n-Bu	H	0	1.529	2-CF3	n-Bu	Me	0
1.500	2-CF3	n-Bu	H	1	1.530	2-CF3	n-Bu	Me	1
1.501	2-CF3	n-Bu	H	2	1.531	2-CF3	n-Bu	Me	2
1.502	2-CF3	i-Bu	H	0	1.532	2-CF3	i-Bu	Me	0
1.503	2-CF3	i-Bu	H	1	1.533	2-CF3	i-Bu	Me	1
1.504	2-CF3	i-Bu	H	2	1.534	2-CF3	i-Bu	Me	2
1.505	2-CF3	s-Bu	H	0	1.535	2-CF3	s-Bu	Me	0
1.506	2-CF3	s-Bu	H	1	1.536	2-CF3	s-Bu	Me	1
1.507	2-CF3	s-Bu	H	2	1.537	2-CF3	s-Bu	Me	2
1.508	2-CF3	t-Bu	H	0	1.538	2-CF3	t-Bu	Me	0
1.509	2-CF3	t-Bu	H	1	1.539	2-CF3	t-Bu	Me	1
1.510	2-CF3	t-Bu	H	2	1.540	2-CF3	t-Bu	Me	2

【0047】

【表10】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.541	3-CF3	H	H	0	1.571	3-CF3	H	Me	0
1.542	3-CF3	H	H	1	1.572	3-CF3	H	Me	1
1.543	3-CF3	H	H	2	1.573	3-CF3	H	Me	2
1.544	3-CF3	Me	H	0	1.574	3-CF3	Me	Me	0
1.545	3-CF3	Me	H	1	1.575	3-CF3	Me	Me	1
1.546	3-CF3	Me	H	2	1.576	3-CF3	Me	Me	2
1.547	3-CF3	Et	H	0	1.577	3-CF3	Et	Me	0
1.548	3-CF3	Et	H	1	1.578	3-CF3	Et	Me	1
1.549	3-CF3	Et	H	2	1.579	3-CF3	Et	Me	2
1.550	3-CF3	n-Pr	H	0	1.580	3-CF3	n-Pr	Me	0
1.551	3-CF3	n-Pr	H	1	1.581	3-CF3	n-Pr	Me	1
1.552	3-CF3	n-Pr	H	2	1.582	3-CF3	n-Pr	Me	2
1.553	3-CF3	i-Pr	H	0	1.583	3-CF3	i-Pr	Me	0
1.554	3-CF3	i-Pr	H	1	1.584	3-CF3	i-Pr	Me	1
1.555	3-CF3	i-Pr	H	2	1.585	3-CF3	i-Pr	Me	2
1.556	3-CF3	o-Pr	H	0	1.586	3-CF3	o-Pr	Me	0
1.557	3-CF3	o-Pr	H	1	1.587	3-CF3	o-Pr	Me	1
1.558	3-CF3	o-Pr	H	2	1.588	3-CF3	o-Pr	Me	2
1.559	3-CF3	n-Bu	H	0	1.589	3-CF3	n-Bu	Me	0
1.560	3-CF3	n-Bu	H	1	1.590	3-CF3	n-Bu	Me	1
1.561	3-CF3	n-Bu	H	2	1.591	3-CF3	n-Bu	Me	2
1.562	3-CF3	i-Bu	H	0	1.592	3-CF3	i-Bu	Me	0
1.563	3-CF3	i-Bu	H	1	1.593	3-CF3	i-Bu	Me	1
1.564	3-CF3	i-Bu	H	2	1.594	3-CF3	i-Bu	Me	2
1.565	3-CF3	s-Bu	H	0	1.595	3-CF3	s-Bu	Me	0
1.566	3-CF3	s-Bu	H	1	1.596	3-CF3	s-Bu	Me	1
1.567	3-CF3	s-Bu	H	2	1.597	3-CF3	s-Bu	Me	2
1.568	3-CF3	t-Bu	H	0	1.598	3-CF3	t-Bu	Me	0
1.569	3-CF3	t-Bu	H	1	1.599	3-CF3	t-Bu	Me	1
1.570	3-CF3	t-Bu	H	2	1.600	3-CF3	t-Bu	Me	2

【0048】

【表11】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.601	4-CF ₃	H	H	0	1.631	4-CF ₃	H	Me	0
1.602	4-CF ₃	H	H	1	1.632	4-CF ₃	H	Me	1
1.603	4-CF ₃	H	H	2	1.633	4-CF ₃	H	Me	2
1.604	4-CF ₃	Me	H	0	1.634	4-CF ₃	Me	Me	0
1.605	4-CF ₃	Me	H	1	1.635	4-CF ₃	Me	Me	1
1.606	4-CF ₃	Me	H	2	1.636	4-CF ₃	Me	Me	2
1.607	4-CF ₃	Et	H	0	1.637	4-CF ₃	Et	Me	0
1.608	4-CF ₃	Et	H	1	1.638	4-CF ₃	Et	Me	1
1.609	4-CF ₃	Et	H	2	1.639	4-CF ₃	Et	Me	2
1.610	4-CF ₃	n-Pr	H	0	1.640	4-CF ₃	n-Pr	Me	0
1.611	4-CF ₃	n-Pr	H	1	1.641	4-CF ₃	n-Pr	Me	1
1.612	4-CF ₃	n-Pr	H	2	1.642	4-CF ₃	n-Pr	Me	2
1.613	4-CF ₃	i-Pr	H	0	1.643	4-CF ₃	i-Pr	Me	0
1.614	4-CF ₃	i-Pr	H	1	1.644	4-CF ₃	i-Pr	Me	1
1.615	4-CF ₃	i-Pr	H	2	1.645	4-CF ₃	i-Pr	Me	2
1.616	4-CF ₃	c-Pr	H	0	1.646	4-CF ₃	c-Pr	Me	0
1.617	4-CF ₃	c-Pr	H	1	1.647	4-CF ₃	c-Pr	Me	1
1.618	4-CF ₃	c-Pr	H	2	1.648	4-CF ₃	c-Pr	Me	2
1.619	4-CF ₃	n-Bu	H	0	1.649	4-CF ₃	n-Bu	Me	0
1.620	4-CF ₃	n-Bu	H	1	1.650	4-CF ₃	n-Bu	Me	1
1.621	4-CF ₃	n-Bu	H	2	1.651	4-CF ₃	n-Bu	Me	2
1.622	4-CF ₃	i-Bu	H	0	1.652	4-CF ₃	i-Bu	Me	0
1.623	4-CF ₃	i-Bu	H	1	1.653	4-CF ₃	i-Bu	Me	1
1.624	4-CF ₃	i-Bu	H	2	1.654	4-CF ₃	i-Bu	Me	2
1.625	4-CF ₃	s-Bu	H	0	1.655	4-CF ₃	s-Bu	Me	0
1.626	4-CF ₃	s-Bu	H	1	1.656	4-CF ₃	s-Bu	Me	1
1.627	4-CF ₃	s-Bu	H	2	1.657	4-CF ₃	s-Bu	Me	2
1.628	4-CF ₃	t-Bu	H	0	1.658	4-CF ₃	t-Bu	Me	0
1.629	4-CF ₃	t-Bu	H	1	1.659	4-CF ₃	t-Bu	Me	1
1.630	4-CF ₃	t-Bu	H	2	1.660	4-CF ₃	t-Bu	Me	2

【0049】

【表12】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 号	Xm	R1	R2	n
1.661	2-Cl	H	H	0	1.691	2-Cl	H	Me	0
1.662	2-Cl	H	H	1	1.692	2-Cl	H	Me	1
1.663	2-Cl	H	H	2	1.693	2-Cl	H	Me	2
1.664	2-Cl	Me	H	0	1.694	2-Cl	Me	Me	0
1.665	2-Cl	Me	H	1	1.695	2-Cl	Me	Me	1
1.666	2-Cl	Me	H	2	1.696	2-Cl	Me	Me	2
1.667	2-Cl	Et	H	0	1.697	2-Cl	Et	Me	0
1.668	2-Cl	Et	H	1	1.698	2-Cl	Et	Me	1
1.669	2-Cl	Et	H	2	1.699	2-Cl	Et	Me	2
1.670	2-Cl	n-Pr	H	0	1.700	2-Cl	n-Pr	Me	0
1.671	2-Cl	n-Pr	H	1	1.701	2-Cl	n-Pr	Me	1
1.672	2-Cl	n-Pr	H	2	1.702	2-Cl	n-Pr	Me	2
1.673	2-Cl	i-Pr	H	0	1.703	2-Cl	i-Pr	Me	0
1.674	2-Cl	i-Pr	H	1	1.704	2-Cl	i-Pr	Me	1
1.675	2-Cl	i-Pr	H	2	1.705	2-Cl	i-Pr	Me	2
1.676	2-Cl	c-Pr	H	0	1.706	2-Cl	c-Pr	Me	0
1.677	2-Cl	c-Pr	H	1	1.707	2-Cl	c-Pr	Me	1
1.678	2-Cl	c-Pr	H	2	1.708	2-Cl	c-Pr	Me	2
1.679	2-Cl	n-Bu	H	0	1.709	2-Cl	n-Bu	Me	0
1.680	2-Cl	n-Bu	H	1	1.710	2-Cl	n-Bu	Me	1
1.681	2-Cl	n-Bu	H	2	1.711	2-Cl	n-Bu	Me	2
1.682	2-Cl	i-Bu	H	0	1.712	2-Cl	i-Bu	Me	0
1.683	2-Cl	i-Bu	H	1	1.713	2-Cl	i-Bu	Me	1
1.684	2-Cl	i-Bu	H	2	1.714	2-Cl	i-Bu	Me	2
1.685	2-Cl	s-Bu	H	0	1.715	2-Cl	s-Bu	Me	0
1.686	2-Cl	s-Bu	H	1	1.716	2-Cl	s-Bu	Me	1
1.687	2-Cl	s-Bu	H	2	1.717	2-Cl	s-Bu	Me	2
1.688	2-Cl	t-Bu	H	0	1.718	2-Cl	t-Bu	Me	0
1.689	2-Cl	t-Bu	H	1	1.719	2-Cl	t-Bu	Me	1
1.690	2-Cl	t-Bu	H	2	1.720	2-Cl	t-Bu	Me	2

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.721	3-Cl	H	H	0	1.751	3-Cl	H	Me	0
1.722	3-Cl	H	H	1	1.752	3-Cl	H	Me	1
1.723	3-Cl	H	H	2	1.753	3-Cl	H	Me	2
1.724	3-Cl	Me	H	0	1.754	3-Cl	Me	Me	0
1.725	3-Cl	Me	H	1	1.755	3-Cl	Me	Me	1
1.726	3-Cl	Me	H	2	1.756	3-Cl	Me	Me	2
1.727	3-Cl	Et	H	0	1.757	3-Cl	Et	Me	0
1.728	3-Cl	Et	H	1	1.758	3-Cl	Et	Me	1
1.729	3-Cl	Et	H	2	1.759	3-Cl	Et	Me	2
1.730	3-Cl	n-Pr	H	0	1.760	3-Cl	n-Pr	Me	0
1.731	3-Cl	n-Pr	H	1	1.761	3-Cl	n-Pr	Me	1
1.732	3-Cl	n-Pr	H	2	1.762	3-Cl	n-Pr	Me	2
1.733	3-Cl	i-Pr	H	0	1.763	3-Cl	i-Pr	Me	0
1.734	3-Cl	i-Pr	H	1	1.764	3-Cl	i-Pr	Me	1
1.735	3-Cl	i-Pr	H	2	1.765	3-Cl	i-Pr	Me	2
1.736	3-Cl	c-Pr	H	0	1.766	3-Cl	c-Pr	Me	0
1.737	3-Cl	c-Pr	H	1	1.767	3-Cl	c-Pr	Me	1
1.738	3-Cl	c-Pr	H	2	1.768	3-Cl	c-Pr	Me	2
1.739	3-Cl	n-Bu	H	0	1.769	3-Cl	n-Bu	Me	0
1.740	3-Cl	n-Bu	H	1	1.770	3-Cl	n-Bu	Me	1
1.741	3-Cl	n-Bu	H	2	1.771	3-Cl	n-Bu	Me	2
1.742	3-Cl	i-Bu	H	0	1.772	3-Cl	i-Bu	Me	0
1.743	3-Cl	i-Bu	H	1	1.773	3-Cl	i-Bu	Me	1
1.744	3-Cl	i-Bu	H	2	1.774	3-Cl	i-Bu	Me	2
1.745	3-Cl	s-Bu	H	0	1.775	3-Cl	s-Bu	Me	0
1.746	3-Cl	s-Bu	H	1	1.776	3-Cl	s-Bu	Me	1
1.747	3-Cl	s-Bu	H	2	1.777	3-Cl	s-Bu	Me	2
1.748	3-Cl	t-Bu	H	0	1.778	3-Cl	t-Bu	Me	0
1.749	3-Cl	t-Bu	H	1	1.779	3-Cl	t-Bu	Me	1
1.750	3-Cl	t-Bu	H	2	1.780	3-Cl	t-Bu	Me	2

【0051】

【表14】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.781	4-Cl	H	H	0	1.811	4-Cl	H	Me	0
1.782	4-Cl	H	H	1	1.812	4-Cl	H	Me	1
1.783	4-Cl	H	H	2	1.813	4-Cl	H	Me	2
1.784	4-Cl	Me	H	0	1.814	4-Cl	Me	Me	0
1.785	4-Cl	Me	H	1	1.815	4-Cl	Me	Me	1
1.786	4-Cl	Me	H	2	1.816	4-Cl	Me	Me	2
1.787	4-Cl	Et	H	0	1.817	4-Cl	Et	Me	0
1.788	4-Cl	Et	H	1	1.818	4-Cl	Et	Me	1
1.789	4-Cl	Et	H	2	1.819	4-Cl	Et	Me	2
1.790	4-Cl	n-Pr	H	0	1.820	4-Cl	n-Pr	Me	0
1.791	4-Cl	n-Pr	H	1	1.821	4-Cl	n-Pr	Me	1
1.792	4-Cl	n-Pr	H	2	1.822	4-Cl	n-Pr	Me	2
1.793	4-Cl	i-Pr	H	0	1.823	4-Cl	i-Pr	Me	0
1.794	4-Cl	i-Pr	H	1	1.824	4-Cl	i-Pr	Me	1
1.795	4-Cl	i-Pr	H	2	1.825	4-Cl	i-Pr	Me	2
1.796	4-Cl	c-Pr	H	0	1.826	4-Cl	c-Pr	Me	0
1.797	4-Cl	c-Pr	H	1	1.827	4-Cl	c-Pr	Me	1
1.798	4-Cl	c-Pr	H	2	1.828	4-Cl	c-Pr	Me	2
1.799	4-Cl	n-Bu	H	0	1.829	4-Cl	n-Bu	Me	0
1.800	4-Cl	n-Bu	H	1	1.830	4-Cl	n-Bu	Me	1
1.801	4-Cl	n-Bu	H	2	1.831	4-Cl	n-Bu	Me	2
1.802	4-Cl	i-Bu	H	0	1.832	4-Cl	i-Bu	Me	0
1.803	4-Cl	i-Bu	H	1	1.833	4-Cl	i-Bu	Me	1
1.804	4-Cl	i-Bu	H	2	1.834	4-Cl	i-Bu	Me	2
1.805	4-Cl	s-Bu	H	0	1.835	4-Cl	s-Bu	Me	0
1.806	4-Cl	s-Bu	H	1	1.836	4-Cl	s-Bu	Me	1
1.807	4-Cl	s-Bu	H	2	1.837	4-Cl	s-Bu	Me	2
1.808	4-Cl	t-Bu	H	0	1.838	4-Cl	t-Bu	Me	0
1.809	4-Cl	t-Bu	H	1	1.839	4-Cl	t-Bu	Me	1
1.810	4-Cl	t-Bu	H	2	1.840	4-Cl	t-Bu	Me	2

[0052]

【表15】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.841	2-OMe	H	H	0	1.871	2-OMe	H	Me	0
1.842	2-OMe	H	H	1	1.872	2-OMe	H	Me	1
1.843	2-OMe	H	H	2	1.873	2-OMe	H	Me	2
1.844	2-OMe	Me	H	0	1.874	2-OMe	Me	Me	0
1.845	2-OMe	Me	H	1	1.875	2-OMe	Me	Me	1
1.846	2-OMe	Me	H	2	1.876	2-OMe	Me	Me	2
1.847	2-OMe	Et	H	0	1.877	2-OMe	Et	Me	0
1.848	2-OMe	Et	H	1	1.878	2-OMe	Et	Me	1
1.849	2-OMe	Et	H	2	1.879	2-OMe	Et	Me	2
1.850	2-OMe	n-Pr	H	0	1.880	2-OMe	n-Pr	Me	0
1.851	2-OMe	n-Pr	H	1	1.881	2-OMe	n-Pr	Me	1
1.852	2-OMe	n-Pr	H	2	1.882	2-OMe	n-Pr	Me	2
1.853	2-OMe	i-Pr	H	0	1.883	2-OMe	i-Pr	Me	0
1.854	2-OMe	i-Pr	H	1	1.884	2-OMe	i-Pr	Me	1
1.855	2-OMe	i-Pr	H	2	1.885	2-OMe	i-Pr	Me	2
1.856	2-OMe	c-Pr	H	0	1.886	2-OMe	c-Pr	Me	0
1.857	2-OMe	c-Pr	H	1	1.887	2-OMe	c-Pr	Me	1
1.858	2-OMe	c-Pr	H	2	1.888	2-OMe	c-Pr	Me	2
1.859	2-OMe	n-Bu	H	0	1.889	2-OMe	n-Bu	Me	0
1.860	2-OMe	n-Bu	H	1	1.890	2-OMe	n-Bu	Me	1
1.861	2-OMe	n-Bu	H	2	1.891	2-OMe	n-Bu	Me	2
1.862	2-OMe	i-Bu	H	0	1.892	2-OMe	i-Bu	Me	0
1.863	2-OMe	i-Bu	H	1	1.893	2-OMe	i-Bu	Me	1
1.864	2-OMe	i-Bu	H	2	1.894	2-OMe	i-Bu	Me	2
1.865	2-OMe	s-Bu	H	0	1.895	2-OMe	s-Bu	Me	0
1.866	2-OMe	s-Bu	H	1	1.896	2-OMe	s-Bu	Me	1
1.867	2-OMe	s-Bu	H	2	1.897	2-OMe	s-Bu	Me	2
1.868	2-OMe	t-Bu	H	0	1.898	2-OMe	t-Bu	Me	0
1.869	2-OMe	t-Bu	H	1	1.899	2-OMe	t-Bu	Me	1
1.870	2-OMe	t-Bu	H	2	1.900	2-OMe	t-Bu	Me	2

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.901	3-OMe	H	H	0	1.931	3-OMe	H	Me	0
1.902	3-OMe	H	H	1	1.932	3-OMe	H	Me	1
1.903	3-OMe	H	H	2	1.933	3-OMe	H	Me	2
1.904	3-OMe	Me	H	0	1.934	3-OMe	Me	Me	0
1.905	3-OMe	Me	H	1	1.935	3-OMe	Me	Me	1
1.906	3-OMe	Me	H	2	1.936	3-OMe	Me	Me	2
1.907	3-OMe	Et	H	0	1.937	3-OMe	Et	Me	0
1.908	3-OMe	Et	H	1	1.938	3-OMe	Et	Me	1
1.909	3-OMe	Et	H	2	1.939	3-OMe	Et	Me	2
1.910	3-OMe	n-Pr	H	0	1.940	3-OMe	n-Pr	Me	0
1.911	3-OMe	n-Pr	H	1	1.941	3-OMe	n-Pr	Me	1
1.912	3-OMe	n-Pr	H	2	1.942	3-OMe	n-Pr	Me	2
1.913	3-OMe	i-Pr	H	0	1.943	3-OMe	i-Pr	Me	0
1.914	3-OMe	i-Pr	H	1	1.944	3-OMe	i-Pr	Me	1
1.915	3-OMe	i-Pr	H	2	1.945	3-OMe	i-Pr	Me	2
1.916	3-OMe	c-Pr	H	0	1.946	3-OMe	c-Pr	Me	0
1.917	3-OMe	c-Pr	H	1	1.947	3-OMe	c-Pr	Me	1
1.918	3-OMe	c-Pr	H	2	1.948	3-OMe	c-Pr	Me	2
1.919	3-OMe	n-Bu	H	0	1.949	3-OMe	n-Bu	Me	0
1.920	3-OMe	n-Bu	H	1	1.950	3-OMe	n-Bu	Me	1
1.921	3-OMe	n-Bu	H	2	1.951	3-OMe	n-Bu	Me	2
1.922	3-OMe	i-Bu	H	0	1.952	3-OMe	i-Bu	Me	0
1.923	3-OMe	i-Bu	H	1	1.953	3-OMe	i-Bu	Me	1
1.924	3-OMe	i-Bu	H	2	1.954	3-OMe	i-Bu	Me	2
1.925	3-OMe	s-Bu	H	0	1.955	3-OMe	s-Bu	Me	0
1.926	3-OMe	s-Bu	H	1	1.956	3-OMe	s-Bu	Me	1
1.927	3-OMe	s-Bu	H	2	1.957	3-OMe	s-Bu	Me	2
1.928	3-OMe	t-Bu	H	0	1.958	3-OMe	t-Bu	Me	0
1.929	3-OMe	t-Bu	H	1	1.959	3-OMe	t-Bu	Me	1
1.930	3-OMe	t-Bu	H	2	1.960	3-OMe	t-Bu	Me	2

【0054】

【表17】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.961	4-OMe	H	H	0	1.991	4-OMe	H	Me	0
1.962	4-OMe	H	H	1	1.992	4-OMe	H	Me	1
1.963	4-OMe	H	H	2	1.993	4-OMe	H	Me	2
1.964	4-OMe	Me	H	0	1.994	4-OMe	Me	Me	0
1.965	4-OMe	Me	H	1	1.995	4-OMe	Me	Me	1
1.966	4-OMe	Me	H	2	1.996	4-OMe	Me	Me	2
1.967	4-OMe	Et	H	0	1.997	4-OMe	Et	Me	0
1.968	4-OMe	Et	H	1	1.998	4-OMe	Et	Me	1
1.969	4-OMe	Et	H	2	1.999	4-OMe	Et	Me	2
1.970	4-OMe	n-Pr	H	0	1.1000	4-OMe	n-Pr	Me	0
1.971	4-OMe	n-Pr	H	1	1.1001	4-OMe	n-Pr	Me	1
1.972	4-OMe	n-Pr	H	2	1.1002	4-OMe	n-Pr	Me	2
1.973	4-OMe	i-Pr	H	0	1.1003	4-OMe	i-Pr	Me	0
1.974	4-OMe	i-Pr	H	1	1.1004	4-OMe	i-Pr	Me	1
1.975	4-OMe	i-Pr	H	2	1.1005	4-OMe	i-Pr	Me	2
1.976	4-OMe	c-Pr	H	0	1.1006	4-OMe	c-Pr	Me	0
1.977	4-OMe	c-Pr	H	1	1.1007	4-OMe	c-Pr	Me	1
1.978	4-OMe	c-Pr	H	2	1.1008	4-OMe	c-Pr	Me	2
1.979	4-OMe	n-Bu	H	0	1.1009	4-OMe	n-Bu	Me	0
1.980	4-OMe	n-Bu	H	1	1.1010	4-OMe	n-Bu	Me	1
1.981	4-OMe	n-Bu	H	2	1.1011	4-OMe	n-Bu	Me	2
1.982	4-OMe	i-Bu	H	0	1.1012	4-OMe	i-Bu	Me	0
1.983	4-OMe	i-Bu	H	1	1.1013	4-OMe	i-Bu	Me	1
1.984	4-OMe	i-Bu	H	2	1.1014	4-OMe	i-Bu	Me	2
1.985	4-OMe	s-Bu	H	0	1.1015	4-OMe	s-Bu	Me	0
1.986	4-OMe	s-Bu	H	1	1.1016	4-OMe	s-Bu	Me	1
1.987	4-OMe	s-Bu	H	2	1.1017	4-OMe	s-Bu	Me	2
1.988	4-OMe	t-Bu	H	0	1.1018	4-OMe	t-Bu	Me	0
1.989	4-OMe	t-Bu	H	1	1.1019	4-OMe	t-Bu	Me	1
1.990	4-OMe	t-Bu	H	2	1.1020	4-OMe	t-Bu	Me	2

【0055】

【表18】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.1021	2-F	H	H	0	1.1051	2-F	H	Me	0
1.1022	2-F	H	H	1	1.1052	2-F	H	Me	1
1.1023	2-F	H	H	2	1.1053	2-F	H	Me	2
1.1024	2-F	Me	H	0	1.1054	2-F	Me	Me	0
1.1025	2-F	Me	H	1	1.1055	2-F	Me	Me	1
1.1026	2-F	Me	H	2	1.1056	2-F	Me	Me	2
1.1027	2-F	Et	H	0	1.1057	2-F	Et	Me	0
1.1028	2-F	Et	H	1	1.1058	2-F	Et	Me	1
1.1029	2-F	Et	H	2	1.1059	2-F	Et	Me	2
1.1030	2-F	n-Pr	H	0	1.1060	2-F	n-Pr	Me	0
1.1031	2-F	n-Pr	H	1	1.1061	2-F	n-Pr	Me	1
1.1032	2-F	n-Pr	H	2	1.1062	2-F	n-Pr	Me	2
1.1033	2-F	i-Pr	H	0	1.1063	2-F	i-Pr	Me	0
1.1034	2-F	i-Pr	H	1	1.1064	2-F	i-Pr	Me	1
1.1035	2-F	i-Pr	H	2	1.1065	2-F	i-Pr	Me	2
1.1036	2-F	c-Pr	H	0	1.1066	2-F	c-Pr	Me	0
1.1037	2-F	c-Pr	H	1	1.1067	2-F	c-Pr	Me	1
1.1038	2-F	c-Pr	H	2	1.1068	2-F	c-Pr	Me	2
1.1039	2-F	n-Bu	H	0	1.1069	2-F	n-Bu	Me	0
1.1040	2-F	n-Bu	H	1	1.1070	2-F	n-Bu	Me	1
1.1041	2-F	n-Bu	H	2	1.1071	2-F	n-Bu	Me	2
1.1042	2-F	i-Bu	H	0	1.1072	2-F	i-Bu	Me	0
1.1043	2-F	i-Bu	H	1	1.1073	2-F	i-Bu	Me	1
1.1044	2-F	i-Bu	H	2	1.1074	2-F	i-Bu	Me	2
1.1045	2-F	s-Bu	H	0	1.1075	2-F	s-Bu	Me	0
1.1046	2-F	s-Bu	H	1	1.1076	2-F	s-Bu	Me	1
1.1047	2-F	s-Bu	H	2	1.1077	2-F	s-Bu	Me	2
1.1048	2-F	t-Bu	H	0	1.1078	2-F	t-Bu	Me	0
1.1049	2-F	t-Bu	H	1	1.1079	2-F	t-Bu	Me	1
1.1050	2-F	t-Bu	H	2	1.1080	2-F	t-Bu	Me	2

【0056】

【表19】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.1081	3-F	H	H	0	1.1111	3-F	H	Me	0
1.1082	3-F	H	H	1	1.1112	3-F	H	Me	1
1.1083	3-F	H	H	2	1.1113	3-F	H	Me	2
1.1084	3-F	Me	H	0	1.1114	3-F	Me	Me	0
1.1085	3-F	Me	H	1	1.1115	3-F	Me	Me	1
1.1086	3-F	Me	H	2	1.1116	3-F	Me	Me	2
1.1087	3-F	Et	H	0	1.1117	3-F	Et	Me	0
1.1088	3-F	Et	H	1	1.1118	3-F	Et	Me	1
1.1089	3-F	Et	H	2	1.1119	3-F	Et	Me	2
1.1090	3-F	n-Pr	H	0	1.1120	3-F	n-Pr	Me	0
1.1091	3-F	n-Pr	H	1	1.1121	3-F	n-Pr	Me	1
1.1092	3-F	n-Pr	H	2	1.1122	3-F	n-Pr	Me	2
1.1093	3-F	i-Pr	H	0	1.1123	3-F	i-Pr	Me	0
1.1094	3-F	i-Pr	H	1	1.1124	3-F	i-Pr	Me	1
1.1095	3-F	i-Pr	H	2	1.1125	3-F	i-Pr	Me	2
1.1096	3-F	c-Pr	H	0	1.1126	3-F	c-Pr	Me	0
1.1097	3-F	c-Pr	H	1	1.1127	3-F	c-Pr	Me	1
1.1098	3-F	c-Pr	H	2	1.1128	3-F	c-Pr	Me	2
1.1099	3-F	n-Bu	H	0	1.1129	3-F	n-Bu	Me	0
1.1100	3-F	n-Bu	H	1	1.1130	3-F	n-Bu	Me	1
1.1101	3-F	n-Bu	H	2	1.1131	3-F	n-Bu	Me	2
1.1102	3-F	i-Bu	H	0	1.1132	3-F	i-Bu	Me	0
1.1103	3-F	i-Bu	H	1	1.1133	3-F	i-Bu	Me	1
1.1104	3-F	i-Bu	H	2	1.1134	3-F	i-Bu	Me	2
1.1105	3-F	s-Bu	H	0	1.1135	3-F	s-Bu	Me	0
1.1106	3-F	s-Bu	H	1	1.1136	3-F	s-Bu	Me	1
1.1107	3-F	s-Bu	H	2	1.1137	3-F	s-Bu	Me	2
1.1108	3-F	t-Bu	H	0	1.1138	3-F	t-Bu	Me	0
1.1109	3-F	t-Bu	H	1	1.1139	3-F	t-Bu	Me	1
1.1110	3-F	t-Bu	H	2	1.1140	3-F	t-Bu	Me	2

【0057】

【表20】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.1141	4-F	H	H	0	1.1171	4-F	H	Me	0
1.1142	4-F	H	H	1	1.1172	4-F	H	Me	1
1.1143	4-F	H	H	2	1.1173	4-F	H	Me	2
1.1144	4-F	Me	H	0	1.1174	4-F	Me	Me	0
1.1145	4-F	Me	H	1	1.1175	4-F	Me	Me	1
1.1146	4-F	Me	H	2	1.1176	4-F	Me	Me	2
1.1147	4-F	Et	H	0	1.1177	4-F	Et	Me	0
1.1148	4-F	Et	H	1	1.1178	4-F	Et	Me	1
1.1149	4-F	Et	H	2	1.1179	4-F	Et	Me	2
1.1150	4-F	n-Pr	H	0	1.1180	4-F	n-Pr	Me	0
1.1151	4-F	n-Pr	H	1	1.1181	4-F	n-Pr	Me	1
1.1152	4-F	n-Pr	H	2	1.1182	4-F	n-Pr	Me	2
1.1153	4-F	i-Pr	H	0	1.1183	4-F	i-Pr	Me	0
1.1154	4-F	i-Pr	H	1	1.1184	4-F	i-Pr	Me	1
1.1155	4-F	i-Pr	H	2	1.1185	4-F	i-Pr	Me	2
1.1156	4-F	c-Pr	H	0	1.1186	4-F	c-Pr	Me	0
1.1157	4-F	c-Pr	H	1	1.1187	4-F	c-Pr	Me	1
1.1158	4-F	c-Pr	H	2	1.1188	4-F	c-Pr	Me	2
1.1159	4-F	n-Bu	H	0	1.1189	4-F	n-Bu	Me	0
1.1160	4-F	n-Bu	H	1	1.1190	4-F	n-Bu	Me	1
1.1161	4-F	n-Bu	H	2	1.1191	4-F	n-Bu	Me	2
1.1162	4-F	i-Bu	H	0	1.1192	4-F	i-Bu	Me	0
1.1163	4-F	i-Bu	H	1	1.1193	4-F	i-Bu	Me	1
1.1164	4-F	i-Bu	H	2	1.1194	4-F	i-Bu	Me	2
1.1165	4-F	s-Bu	H	0	1.1195	4-F	s-Bu	Me	0
1.1166	4-F	s-Bu	H	1	1.1196	4-F	s-Bu	Me	1
1.1167	4-F	s-Bu	H	2	1.1197	4-F	s-Bu	Me	2
1.1168	4-F	t-Bu	H	0	1.1198	4-F	t-Bu	Me	0
1.1169	4-F	t-Bu	H	1	1.1199	4-F	t-Bu	Me	1
1.1170	4-F	t-Bu	H	2	1.1200	4-F	t-Bu	Me	2

【0058】

【表21】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.1201	2-OCF ₃	H	H	0	1.1231	4-OCF ₃	H	Me	0
1.1202	2-OCF ₃	H	H	1	1.1232	4-OCF ₃	H	Me	1
1.1203	2-OCF ₃	H	H	2	1.1233	4-OCF ₃	H	Me	2
1.1204	2-OCF ₃	Me	H	0	1.1234	4-OCF ₃	Me	Me	0
1.1205	2-OCF ₃	Me	H	1	1.1235	4-OCF ₃	Me	Me	1
1.1206	2-OCF ₃	Me	H	2	1.1236	4-OCF ₃	Me	Me	2
1.1207	2-OCF ₃	H	Me	0	1.1237	2-SMe	H	H	0
1.1208	2-OCF ₃	H	Me	1	1.1238	2-SMe	H	H	1
1.1209	2-OCF ₃	H	Me	2	1.1239	2-SMe	H	H	2
1.1210	2-OCF ₃	Me	Me	0	1.1240	2-SMe	Me	H	0
1.1211	2-OCF ₃	Me	Me	1	1.1241	2-SMe	Me	H	1
1.1212	2-OCF ₃	Me	Me	2	1.1242	2-SMe	Me	H	2
1.1213	3-OCF ₃	H	H	0	1.1243	2-SMe	H	Me	0
1.1214	3-OCF ₃	H	H	1	1.1244	2-SMe	H	Me	1
1.1215	3-OCF ₃	H	H	2	1.1245	2-SMe	H	Me	2
1.1216	3-OCF ₃	Me	H	0	1.1246	2-SMe	Me	Me	0
1.1217	3-OCF ₃	Me	H	1	1.1247	2-SMe	Me	Me	1
1.1218	3-OCF ₃	Me	H	2	1.1248	2-SMe	Me	Me	2
1.1219	3-OCF ₃	H	Me	0	1.1249	3-SMe	H	H	0
1.1220	3-OCF ₃	H	Me	1	1.1250	3-SMe	H	H	1
1.1221	3-OCF ₃	H	Me	2	1.1251	3-SMe	H	H	2
1.1222	3-OCF ₃	Me	Me	0	1.1252	3-SMe	Me	H	0
1.1223	3-OCF ₃	Me	Me	1	1.1253	3-SMe	Me	H	1
1.1224	3-OCF ₃	Me	Me	2	1.1254	3-SMe	Me	H	2
1.1225	4-OCF ₃	H	H	0	1.1255	3-SMe	H	Me	0
1.1226	4-OCF ₃	H	H	1	1.1256	3-SMe	H	Me	1
1.1227	4-OCF ₃	H	H	2	1.1257	3-SMe	H	Me	2
1.1228	4-OCF ₃	Me	H	0	1.1258	3-SMe	Me	Me	0
1.1229	4-OCF ₃	Me	H	1	1.1259	3-SMe	Me	Me	1
1.1230	4-OCF ₃	Me	H	2	1.1260	3-SMe	Me	Me	2

【0059】

【表22】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.1261	4-SMe	H	H	0	1.1291	3-SOMe	H	Me	0
1.1262	4-SMe	H	H	1	1.1292	3-SOMe	H	Me	1
1.1263	4-SMe	H	H	2	1.1293	3-SOMe	H	Me	2
1.1264	4-SMe	Me	H	0	1.1294	3-SOMe	Me	Me	0
1.1265	4-SMe	Me	H	1	1.1295	3-SOMe	Me	Me	1
1.1266	4-SMe	Me	H	2	1.1296	3-SOMe	Me	Me	2
1.1267	4-SMe	H	Me	0	1.1297	4-SOMe	H	H	0
1.1268	4-SMe	H	Me	1	1.1298	4-SOMe	H	H	1
1.1269	4-SMe	H	Me	2	1.1299	4-SOMe	H	H	2
1.1270	4-SMe	Me	Me	0	1.1300	4-SOMe	Me	H	0
1.1271	4-SMe	Me	Me	1	1.1301	4-SOMe	Me	H	1
1.1272	4-SMe	Me	Me	2	1.1302	4-SOMe	Me	H	2
1.1273	2-SOMe	H	H	0	1.1303	4-SOMe	H	Me	0
1.1274	2-SOMe	H	H	1	1.1304	4-SOMe	H	Me	1
1.1275	2-SOMe	H	H	2	1.1305	4-SOMe	H	Me	2
1.1276	2-SOMe	Me	H	0	1.1306	4-SOMe	Me	Me	0
1.1277	2-SOMe	Me	H	1	1.1307	4-SOMe	Me	Me	1
1.1278	2-SOMe	Me	H	2	1.1308	4-SOMe	Me	Me	2
1.1279	2-SOMe	H	Me	0	1.1309	2-SO2Me	H	H	0
1.1280	2-SOMe	H	Me	1	1.1310	2-SO2Me	H	H	1
1.1281	2-SOMe	H	Me	2	1.1311	2-SO2Me	H	H	2
1.1282	2-SOMe	Me	Me	0	1.1312	2-SO2Me	Me	H	0
1.1283	2-SOMe	Me	Me	1	1.1313	2-SO2Me	Me	H	1
1.1284	2-SOMe	Me	Me	2	1.1314	2-SO2Me	Me	H	2
1.1285	3-SOMe	H	H	0	1.1315	2-SO2Me	H	Me	0
1.1286	3-SOMe	H	H	1	1.1316	2-SO2Me	H	Me	1
1.1287	3-SOMe	H	H	2	1.1317	2-SO2Me	H	Me	2
1.1288	3-SOMe	Me	H	0	1.1318	2-SO2Me	Me	Me	0
1.1289	3-SOMe	Me	H	1	1.1319	2-SO2Me	Me	Me	1
1.1290	3-SOMe	Me	H	2	1.1320	2-SO2Me	Me	Me	2

【0060】

【表23】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.1321	3-SO2Me	H	H	0	1.1351	2-CO2Me	H	Me	0
1.1322	3-SO2Me	H	H	1	1.1352	2-CO2Me	H	Me	1
1.1323	3-SO2Me	H	H	2	1.1353	2-CO2Me	H	Me	2
1.1324	3-SO2Me	Me	H	0	1.1354	2-CO2Me	Me	Me	0
1.1325	3-SO2Me	Me	H	1	1.1355	2-CO2Me	Me	Me	1
1.1326	3-SO2Me	Me	H	2	1.1356	2-CO2Me	Me	Me	2
1.1327	3-SO2Me	H	Me	0	1.1357	3-CO2Me	H	H	0
1.1328	3-SO2Me	H	Me	1	1.1358	3-CO2Me	H	H	1
1.1329	3-SO2Me	H	Me	2	1.1359	3-CO2Me	H	H	2
1.1330	3-SO2Me	Me	Me	0	1.1360	3-CO2Me	Me	H	0
1.1331	3-SO2Me	Me	Me	1	1.1361	3-CO2Me	Me	H	1
1.1332	3-SO2Me	Me	Me	2	1.1362	3-CO2Me	Me	H	2
1.1333	4-SO2Me	H	H	0	1.1363	3-CO2Me	H	Me	0
1.1334	4-SO2Me	H	H	1	1.1364	3-CO2Me	H	Me	1
1.1335	4-SO2Me	H	H	2	1.1365	3-CO2Me	H	Me	2
1.1336	4-SO2Me	Me	H	0	1.1366	3-CO2Me	Me	Me	0
1.1337	4-SO2Me	Me	H	1	1.1367	3-CO2Me	Me	Me	1
1.1338	4-SO2Me	Me	H	2	1.1368	3-CO2Me	Me	Me	2
1.1339	4-SO2Me	H	Me	0	1.1369	4-CO2Me	H	H	0
1.1340	4-SO2Me	H	Me	1	1.1370	4-CO2Me	H	H	1
1.1341	4-SO2Me	H	Me	2	1.1371	4-CO2Me	H	H	2
1.1342	4-SO2Me	Me	Me	0	1.1372	4-CO2Me	Me	H	0
1.1343	4-SO2Me	Me	Me	1	1.1373	4-CO2Me	Me	H	1
1.1344	4-SO2Me	Me	Me	2	1.1374	4-CO2Me	Me	H	2
1.1345	2-CO2Me	H	H	0	1.1375	4-CO2Me	H	Me	0
1.1346	2-CO2Me	H	H	1	1.1376	4-CO2Me	H	Me	1
1.1347	2-CO2Me	H	H	2	1.1377	4-CO2Me	H	Me	2
1.1348	2-CO2Me	Me	H	0	1.1378	4-CO2Me	Me	Me	0
1.1349	2-CO2Me	Me	H	1	1.1379	4-CO2Me	Me	Me	1
1.1350	2-CO2Me	Me	H	2	1.1380	4-CO2Me	Me	Me	2

【0061】

【表24】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.1381	2-CN	H	H	0	1.1411	4-CN	H	Me	0
1.1382	2-CN	H	H	1	1.1412	4-CN	H	Me	1
1.1383	2-CN	H	H	2	1.1413	4-CN	H	Me	2
1.1384	2-CN	Me	H	0	1.1414	4-CN	Me	Me	0
1.1385	2-CN	Me	H	1	1.1415	4-CN	Me	Me	1
1.1386	2-CN	Me	H	2	1.1416	4-CN	Me	Me	2
1.1387	2-CN	H	Me	0	1.1417	2-NO2	H	H	0
1.1388	2-CN	H	Me	1	1.1418	2-NO2	H	H	1
1.1389	2-CN	H	Me	2	1.1419	2-NO2	H	H	2
1.1390	2-CN	Me	Me	0	1.1420	2-NO2	Me	H	0
1.1391	2-CN	Me	Me	1	1.1421	2-NO2	Me	H	1
1.1392	2-CN	Me	Me	2	1.1422	2-NO2	Me	H	2
1.1393	3-CN	H	H	0	1.1423	2-NO2	H	Me	0
1.1394	3-CN	H	H	1	1.1424	2-NO2	H	Me	1
1.1395	3-CN	H	H	2	1.1425	2-NO2	H	Me	2
1.1396	3-CN	Me	H	0	1.1426	2-NO2	Me	Me	0
1.1397	3-CN	Me	H	1	1.1427	2-NO2	Me	Me	1
1.1398	3-CN	Me	H	2	1.1428	2-NO2	Me	Me	2
1.1399	3-CN	H	Me	0	1.1429	3-NO2	H	H	0
1.1400	3-CN	H	Me	1	1.1430	3-NO2	H	H	1
1.1401	3-CN	H	Me	2	1.1431	3-NO2	H	H	2
1.1402	3-CN	Me	Me	0	1.1432	3-NO2	Me	H	0
1.1403	3-CN	Me	Me	1	1.1433	3-NO2	Me	H	1
1.1404	3-CN	Me	Me	2	1.1434	3-NO2	Me	H	2
1.1405	4-CN	H	H	0	1.1435	3-NO2	H	Me	0
1.1406	4-CN	H	H	1	1.1436	3-NO2	H	Me	1
1.1407	4-CN	H	H	2	1.1437	3-NO2	H	Me	2
1.1408	4-CN	Me	H	0	1.1438	3-NO2	Me	Me	0
1.1409	4-CN	Me	H	1	1.1439	3-NO2	Me	Me	1
1.1410	4-CN	Me	H	2	1.1440	3-NO2	Me	Me	2

【0062】

【表25】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.1441	4-NO2	H	H	0	1.1471	2,4-Cl2	H	Me	0
1.1442	4-NO2	H	H	1	1.1472	2,4-Cl2	H	Me	1
1.1443	4-NO2	H	H	2	1.1473	2,4-Cl2	H	Me	2
1.1444	4-NO2	Me	H	0	1.1474	2,4-Cl2	Me	Me	0
1.1445	4-NO2	Me	H	1	1.1475	2,4-Cl2	Me	Me	1
1.1446	4-NO2	Me	H	2	1.1476	2,4-Cl2	Me	Me	2
1.1447	4-NO2	H	Me	0	1.1477	2,5-Cl2	H	H	0
1.1448	4-NO2	H	Me	1	1.1478	2,5-Cl2	H	H	1
1.1449	4-NO2	H	Me	2	1.1479	2,5-Cl2	H	H	2
1.1450	4-NO2	Me	Me	0	1.1480	2,5-Cl2	Me	H	0
1.1451	4-NO2	Me	Me	1	1.1481	2,5-Cl2	Me	H	1
1.1452	4-NO2	Me	Me	2	1.1482	2,5-Cl2	Me	H	2
1.1453	2,3-Cl2	H	H	0	1.1483	2,5-Cl2	H	Me	0
1.1454	2,3-Cl2	H	H	1	1.1484	2,5-Cl2	H	Me	1
1.1455	2,3-Cl2	H	H	2	1.1485	2,5-Cl2	H	Me	2
1.1456	2,3-Cl2	Me	H	0	1.1486	2,5-Cl2	Me	Me	0
1.1457	2,3-Cl2	Me	H	1	1.1487	2,5-Cl2	Me	Me	1
1.1458	2,3-Cl2	Me	H	2	1.1488	2,5-Cl2	Me	Me	2
1.1459	2,3-Cl2	H	Me	0	1.1489	2,6-Cl2	H	H	0
1.1460	2,3-Cl2	H	Me	1	1.1490	2,6-Cl2	H	H	1
1.1461	2,3-Cl2	H	Me	2	1.1491	2,6-Cl2	H	H	2
1.1462	2,3-Cl2	Me	Me	0	1.1492	2,6-Cl2	Me	H	0
1.1463	2,3-Cl2	Me	Me	1	1.1493	2,6-Cl2	Me	H	1
1.1464	2,3-Cl2	Me	Me	2	1.1494	2,6-Cl2	Me	H	2
1.1465	2,4-Cl2	H	H	0	1.1495	2,6-Cl2	H	Me	0
1.1466	2,4-Cl2	H	H	1	1.1496	2,6-Cl2	H	Me	1
1.1467	2,4-Cl2	H	H	2	1.1497	2,6-Cl2	H	Me	2
1.1468	2,4-Cl2	Me	H	0	1.1498	2,6-Cl2	Me	Me	0
1.1469	2,4-Cl2	Me	H	1	1.1499	2,6-Cl2	Me	Me	1
1.1470	2,4-Cl2	Me	H	2	1.1500	2,6-Cl2	Me	Me	2

【0063】

【表26】

表1 (続き)

化合物 番号	Xm	R1	R2	n	化合物 番号	Xm	R1	R2	n
1.1501	3,5-Cl2	H	H	0	1.1531	2,4,6-Cl3	H	Me	0
1.1502	3,5-Cl2	H	H	1	1.1532	2,4,6-Cl3	H	Me	1
1.1503	3,5-Cl2	H	H	2	1.1533	2,4,6-Cl3	H	Me	2
1.1504	3,5-Cl2	Me	H	0	1.1534	2,4,6-Cl3	Me	Me	0
1.1505	3,5-Cl2	Me	H	1	1.1535	2,4,6-Cl3	Me	Me	1
1.1506	3,5-Cl2	Me	H	2	1.1536	2,4,6-Cl3	Me	Me	2
1.1507	3,5-Cl2	H	Me	0	1.4537	2-Br	H	H	0
1.1508	3,5-Cl2	H	Me	1	1.1538	2-Br	H	H	1
1.1509	3,5-Cl2	H	Me	2	1.1539	2-Br	H	H	2
1.1510	3,5-Cl2	Me	Me	0	1.1540	2-Br	Me	H	0
1.1511	3,5-Cl2	Me	Me	1	1.1541	2-Br	Me	H	1
1.1512	3,5-Cl2	Me	Me	2	1.1542	2-Br	Me	H	2
1.1513	3,4-Cl2	H	H	0	1.1543	2-Br	H	Me	0
1.1514	3,4-Cl2	H	H	1	1.1544	2-Br	H	Me	1
1.1515	3,4-Cl2	H	H	2	1.1545	2-Br	H	Me	2
1.1516	3,4-Cl2	Me	H	0	1.1546	2-Br	Me	Me	0
1.1517	3,4-Cl2	Me	H	1	1.1547	2-Br	Me	Me	1
1.1518	3,4-Cl2	Me	H	2	1.1548	2-Br	Me	Me	2
1.1519	3,4-Cl2	H	Me	0	1.1549	3-Br	H	H	0
1.1520	3,4-Cl2	H	Me	1	1.1550	3-Br	H	H	1
1.1521	3,4-Cl2	H	Me	2	1.1551	3-Br	H	H	2
1.1522	3,4-Cl2	Me	Me	0	1.1552	3-Br	Me	H	0
1.1523	3,4-Cl2	Me	Me	1	1.1553	3-Br	Me	H	1
1.1524	3,4-Cl2	Me	Me	2	1.1554	3-Br	Me	H	2
1.1525	2,4,6-Cl3	H	H	0	1.1555	3-Br	H	Me	0
1.1526	2,4,6-Cl3	H	H	1	1.1556	3-Br	H	Me	1
1.1527	2,4,6-Cl3	H	H	2	1.1557	3-Br	H	Me	2
1.1528	2,4,6-Cl3	Me	H	0	1.1558	3-Br	Me	Me	0
1.1529	2,4,6-Cl3	Me	H	1	1.1559	3-Br	Me	Me	1
1.1530	2,4,6-Cl3	Me	H	2	1.1560	3-Br	Me	Me	2

【0064】本発明により提供される前記一般式(I)で表わされる本発明の具体例を(化合物群-1)ないし(化合物群-12)として以下に示す。

【0065】(化合物群-1) JがJ-1であり、G₁がCHであり、G₂がOであり、Xm、R₁、R₂及びnが(表1)に示されたと同じである1560個の化合物を含む。

【0066】(化合物群-2) JがJ-1であり、G₁がNであり、G₂がOであり、Xm、R₁、R₂及びnが(表1)に示されたと同じである1560個の化合物を含む。

【0067】(化合物群-3) JがJ-1であり、G₁がNであり、G₂がNHであり、Xm、R₁、R₂及び

nが(表1)に示されたと同じである1560個の化合物を含む。

【0068】(化合物群-4) JがJ-2であり、G₁がCHであり、G₂がOであり、Xm、R₁、R₂及びnが(表1)に示されたと同じである1560個の化合物を含む。

【0069】(化合物群-5) JがJ-2であり、G₁がNであり、G₂がOであり、Xm、R₁、R₂及びnが(表1)に示されたと同じである1560個の化合物を含む。

【0070】(化合物群-6) JがJ-2であり、G₁がNであり、G₂がNHであり、Xm、R₁、R₂及びnが(表1)に示されたと同じである1560個の化合物を含む。

物を含む。

【0071】(化合物群-7) JがJ-3であり、 G_1 がCHであり、 G_2 がOであり、 X_m 、 R_1 、 R_2 及びnが(表1)に示されたと同じである1560個の化合物を含む。

【0072】(化合物群-8) JがJ-3であり、 G_1 がNであり、 G_2 がOであり、 X_m 、 R_1 、 R_2 及びnが(表1)に示されたと同じである1560個の化合物を含む。

【0073】(化合物群-9) JがJ-3であり、 G_1 がNであり、 G_2 がNHであり、 X_m 、 R_1 、 R_2 及びnが(表1)に示されたと同じである1560個の化合物を含む。

【0074】(化合物群-10) JがJ-4であり、 G_1 がCHであり、 G_2 がOであり、 X_m 、 R_1 、 R_2 及びnが(表1)に示されたと同じである1560個の化合物を含む。

化合物を含む。

【0075】(化合物群-11) JがJ-4であり、 G_1 がNであり、 G_2 がOであり、 X_m 、 R_1 、 R_2 及びnが(表1)に示されたと同じである1560個の化合物を含む。

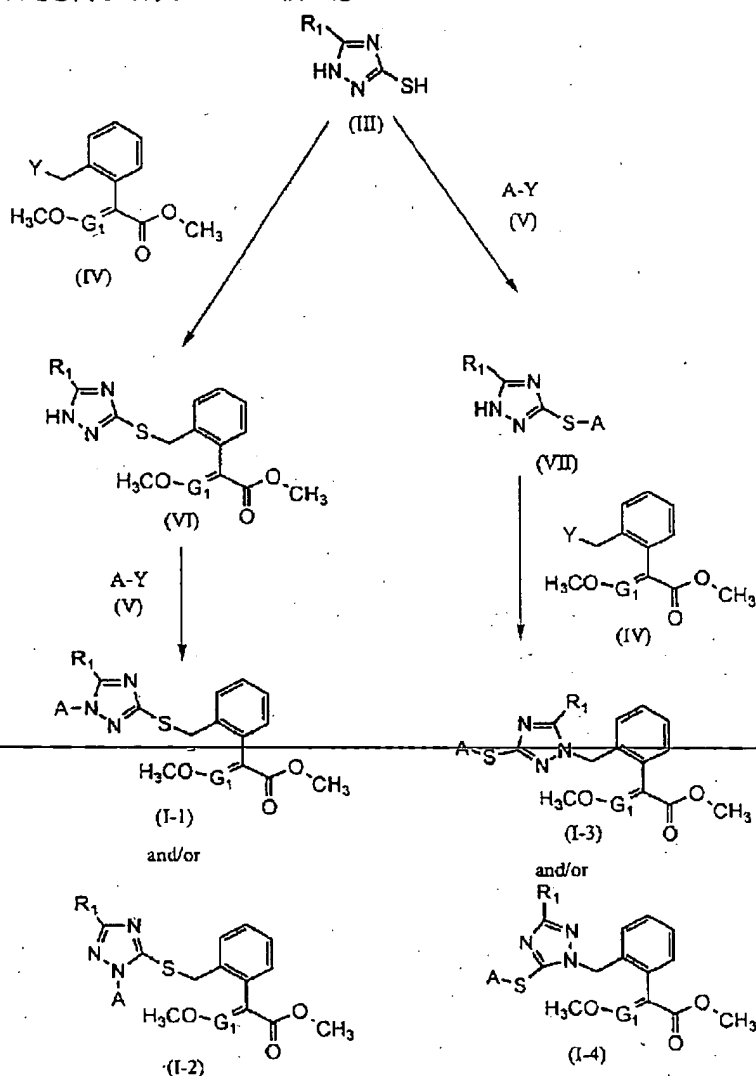
【0076】(化合物群-12) JがJ-4であり、 G_1 がNであり、 G_2 がNHであり、 X_m 、 R_1 、 R_2 及びnが(表1)に示されたと同じである1560個の化合物を含む。

【0077】本発明における前記一般式(I)の化合物はいかなる方法によって得られた物でもよいが、例えば次のような方法によって製造することができる。

【0078】A法

【0079】

【化11】



【0080】[式中、A、 R_1 及び G_1 は、前記一般式(I)における定義と同じ意味を示し、Yはハロゲン原子、アルキルスルフォニルオキシ基またはアリールスルフォニルオキシ基を示す。]

化合物(I-1)、(I-2)、(I-3)及び(I-4)は、式(III)で表わされる化合物と、式(IV)及び式(V)で表わされる化合物とを、順次、適当な溶媒中又は無溶媒で酸結合剤の存在又は非存在下に反応させることによ

り得ることが出来る。

【0081】反応温度は、 -80°C から 150°C もしくは溶媒の沸点の範囲で任意に設定できる。溶媒を使用する場合の溶媒としては原料と反応しないものであれば特に制限なく使用でき、例えばペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルフォキシド、水等が挙げられ、これらの溶媒は単独で用いる事もできるし必要に応じて混合することもできる。また反応時間は、反応温度、反応溶媒等の条件にも依るが一般に0.1~24時間の範囲で行うことができる。使用される酸結合剤としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の金属炭酸塩類、水素化ナトリウム、水素化カ

リウム等の金属水素化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等の金属アルコキシド類、ピリジン、トリエチルアミン、N、N-ジメチルピリジン、ジアザビシクロウンデセン、ジアザビシクロオクタン等の有機塩基類が挙げられる。

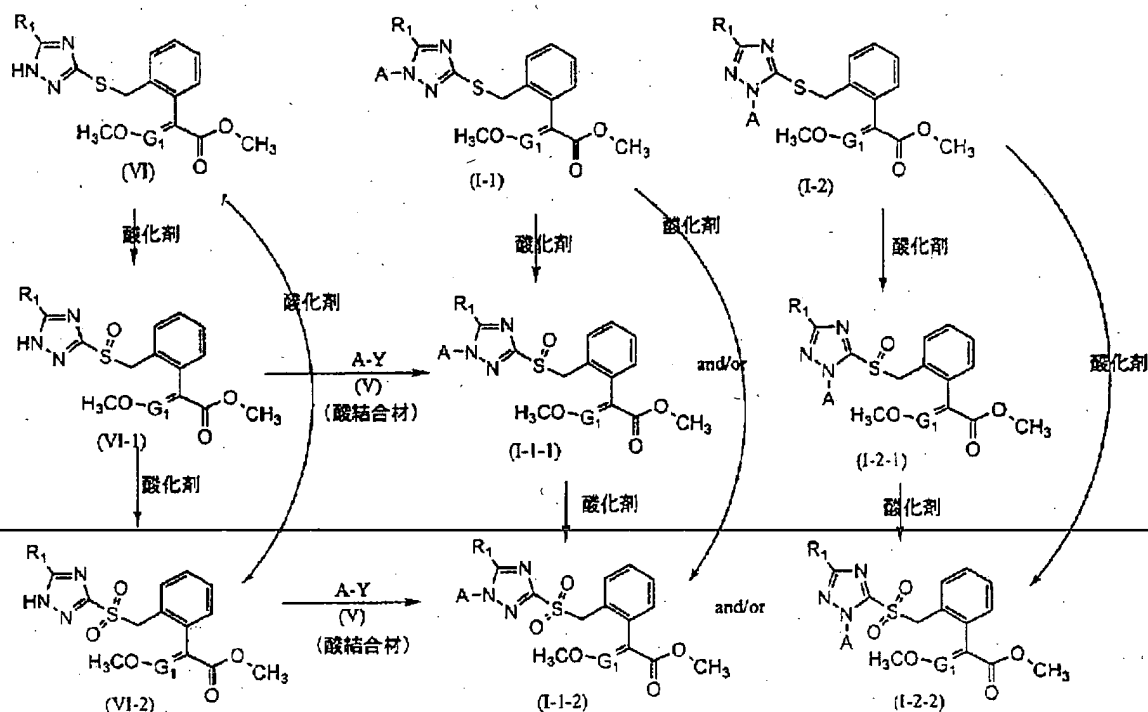
【0082】式(III)の化合物に対する式(IV)及び式(V)の化合物の使用割合、式(VI)の化合物に対する式(V)の化合物の使用割合及び式(VII)の化合物に対する式(IV)の化合物の使用割合は、厳密には制限されないが、通常、式(III)、式(VI)及び式(VII)の化合物1モル当たり式(IV)及び式(V)の化合物は、0.5~2モル、特に0.9~1.1モルの範囲内で用いるのが好都合である。

【0083】生成する式(I-1)、(I-2)、(I-3)及び(I-4)の化合物の反応混合物からの分離、精製はそれ自体既知の方法、例えば、抽出、再結晶、クロマトグラフィー等により行うことができる。

【0084】B法

【0085】

【化12】



【0086】【式中、A、R₁及びG₁は、前記一般式(I)における定義と同じ意味を示し、Yはハロゲン原子、アルキルスルフォニルオキシ基またはアリールスルフォニルオキシ基を示す。】

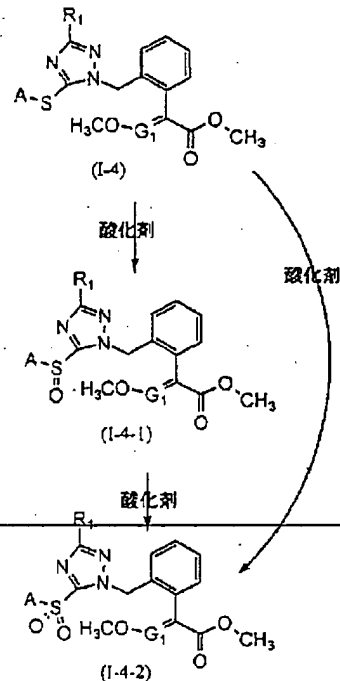
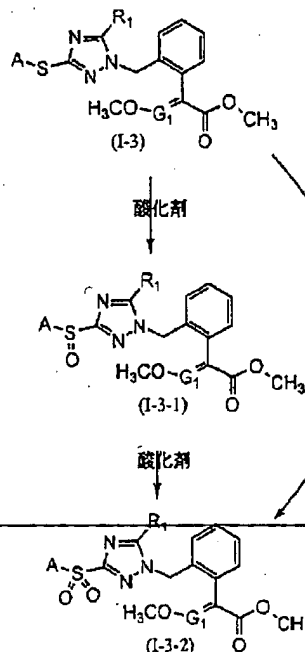
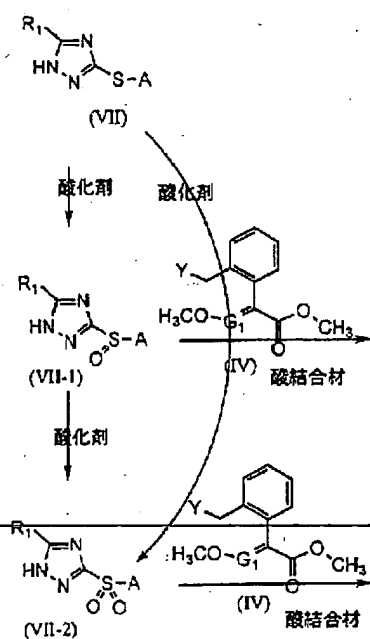
式(I-1-1)、(I-1-2)、(I-2-1)及び(I-2-2)の化合物は式(VI)で表わされる化合物を適宜、酸化反応及び式(V)で表わされる化合物と適当な溶媒中または無溶媒で酸結合剤の存在下での反応に供するか、又は、式

(I-1)及び式(I-2)の化合物を酸化反応に供する事により得ることが出来る。

【0087】式(V)で表される化合物との反応の、反応温度は、 -80°C から 150°C もしくは溶媒の沸点の範囲で任意に設定できる。溶媒を使用する場合の溶媒としては原料と反応しないものであれば、特に制限なく使用でき、例えばペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレンな

どの芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルフォキシド、水等が挙げられ、これらの溶媒は単独で用いる事もできるし必要に応じて混合することもできる。また反応時間は、反応温度、反応溶媒等の条件にも依るが一般に0.1~24時間の範囲で行うことができる。使用される酸結合剤としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の金属炭酸塩類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等の金属アルコキシド類、ピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルピリジン、ジアザビシクロウンデセン、ジアザビシクロオクタン等の有機塩基類が挙げられる。

【0088】式(VI-1)及び(VI-2)の化合物に対する



【0093】[式中、A、R₁及びG₁は、前記一般式(I)における定義と同じ意味を示し、Yはハロゲン原子、アルキルスルフォニルオキシ基又はアリールスルフォニルオキシ基を示す。]

式(I-3-1)、(I-3-2)、(I-4-1)及び(I-4-2)の化合物は式(VII)で表わされる化合物を適宜、酸化反応及び式(IV)で表される化合物と適当な溶媒中又は無溶媒で酸結合剤の存在下での反応に供するか、式(I-

式(V)の化合物の使用割合は、厳密には制限されないが、通常、式(VI-1)及び(VI-2)の化合物1モル当たり式(V)の化合物は、0.5~2モル、特に0.9~1.1モルの範囲内で用いるのが好都合である。

【0089】酸化反応の反応温度は、-80℃から150℃もしくは溶媒の沸点の範囲で任意に設定できる。また反応時間は、反応温度、反応溶媒等の条件にも依るが一般に0.1~24時間の範囲で行うことができる。使用される酸化剤としては、過酢酸、過安息香酸、m-クロロ過安息香酸、モノ過フタル酸マグネシウム塩等の過酸類及び過酸化水素が挙げられ、又、反応溶媒としては、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、蟻酸、酢酸、プロピオン酸等のカルボン酸類、水等が挙げられ、これらの溶媒は単独で用いる事もできるし必要に応じて混合することもできる。

【0090】生成する式(I-1-1)、(I-1-2)、(I-2-1)及び(I-2-2)の化合物の反応混合物からの分離、精製はそれ自体既知の方法、例えば、抽出、再結晶、クロマトグラフィー等により行うことができる。

【0091】C法

【0092】

【化13】

3)又は式(I-4)の化合物を酸化反応に供する事により得ることが出来る。

【0094】式(IV)で表される化合物との反応の反応温度は、-80℃から150℃もしくは溶媒の沸点の範囲で任意に設定できる。溶媒を使用する場合の溶媒としては原料と反応しないものであれば特に制限なく使用でき、例えばペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレンなどの

芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルフォキシド、水等が挙げられ、これらの溶媒は単独で用いる事もできるし必要に応じて混合することもできる。また反応時間は、反応温度、反応溶媒等の条件にも依るが一般に0.1～24時間の範囲で行うことができる。使用される酸結合剤としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の金属炭酸塩類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等の金属アルコキシド類、ピリジン、トリエチルアミン、N、N-ジメチルピリジン、ジアザビシクロウンデセン、ジアザビシクロオクタン等の有機塩基類が挙げられる。

【0095】式(VII-1)及び(VII-2)の化合物に対する式(V)の化合物の使用割合は、厳密には制限されないが、通常、式(VII-1)及び(VII-2)の化合物1モル当たり式(IV)の化合物は、0.5～2モル、特に0.9～1.1モルの範囲内で用いるのが好都合である。

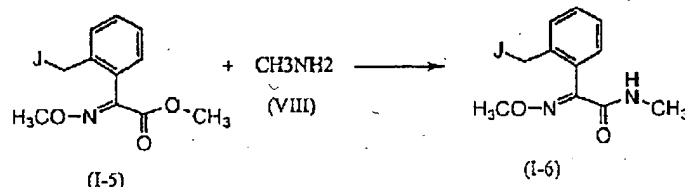
【0096】酸化反応の反応温度は、-80℃から150℃もしくは溶媒の沸点の範囲で任意に設定できる。また反応時間は、反応温度、反応溶媒等の条件にも依るが一般に0.1～24時間の範囲で行うことができる。使用される酸化剤としては、過酢酸、過安息香酸、m-クロロ過安息香酸、モノ過フタル酸マグネシウム塩等の過酸類及び過酸化水素が挙げられ、又、反応溶媒としては、原料と反応しないものであれば特に制限なく使用でき、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、蟻酸、酢酸、プロピオン酸等のカルボン酸類、水等が挙げられ、これらの溶媒は単独で用いる事もできるし必要に応じて混合することもできる。

【0097】生成する式(I-3-1)、(I-3-2)、(I-4-1)及び(I-4-2)の化合物の反応混合物からの分離、精製はそれ自体既知の方法、例えば、抽出、再結晶、クロマトグラフィー等により行うことができる。

【0098】D法

【0099】

【化14】



【0100】[式中、Jは、前記一般式(I)における定義と同じ意味を示す。]式(I-6)の化合物は、式(I-5)の化合物と式(VIII)の化合物とを、適当な溶媒中で反応させることにより得ることが出来る。

【0101】反応温度は、-80℃から150℃もしくは溶媒の沸点の範囲で任意に設定できる。溶媒を使用する場合の溶媒としては原料と反応しないものであれば特に制限なく使用でき、例えばペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルフォキシド、水等が挙げられ、これら

の溶媒は単独で用いる事もできるし必要に応じて混合することもできる。また反応時間は、反応温度、反応溶媒等の条件にも依るが、一般に0.1～24時間の範囲で行うことができる。

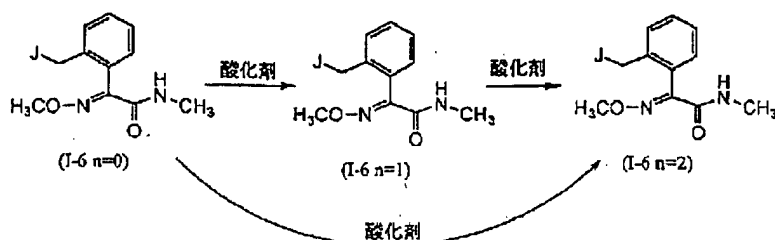
【0102】式(I-6)の化合物に対する式(VIII)の化合物の使用割合は、厳密には制限されないが、通常、式(I-6)の化合物1モル当たり式(VIII)の化合物は、0.5～10モル、特に1～5モルの範囲内で用いるのが好都合である。

【0103】生成する式(I-6)の化合物の反応混合物からの分離、精製はそれ自体既知の方法、例えば、抽出、再結晶、クロマトグラフィー等により行うことができる。

【0104】E法

【0105】

【化15】



【0106】〔式中、Jは、前記一般式(I)における定義と同じ意味を示す。〕

式(I-6 n=1)の化合物は、式(I-6 n=0)の化合物を適当な酸化剤により酸化することにより得ることが出来る。また、式(I-6 n=2)の化合物は、式(I-6 n=0)の化合物又は式(I-6 n=1)の化合物を適当な酸化剤により酸化することにより得ることが出来る。

【0107】酸化反応の反応温度は、-80℃から150℃もしくは溶媒の沸点の範囲で任意に設定できる。また反応時間は、反応温度、反応溶媒等の条件にも依るが一般に0.1～24時間の範囲で行うことができる。使用される酸化剤としては、過酢酸、過安息香酸、m-クロロ過安息香酸、モノ過フタル酸マグネシウム塩等の過酸類及び過酸化水素が挙げられ、また反応溶媒としては原料と反応しないものであれば特に制限なく使用でき、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、蟻酸、酢酸、プロピオン酸等のカルボン酸類、水等が挙げられこれらの溶媒は単独で用いる事もできるし必要に応じて混合することもできる。

【0108】生成する式(I-6 n=1)および(I-6 n=2)の化合物の反応混合物からの分離、精製はそれ自体既知の方法、例えば、抽出、再結晶、クロマトグラフィー等により行うことができる。

【0109】本発明の一般式(I)で表されるトリアゾール誘導体は農園芸用殺菌剤の有効成分として有用であり、例えば稲いもち病(Pyricularia oryzae)、稲紋枯病(Rhizoctonia solani)、稲胡麻葉枯病(Cochibolus miyabeanus)、大麦及び小麦等のうどんこ病(Erysiphe graminis)、の如き種々の宿主植物についてのうどんこ病、エンバクの冠きび病(Puccinia coronata)、トマトの疫病(Phytophthora infestans)、及び他の植物の疫病、キュウリのべと病(Pseudoperonospora cubensis)、ブドウのべと病(Plasmopara viticola)等の種々植物のべと病、リング黒星病(Venturia inaequalis)、リング斑点落葉病(Alternaria mali)、ナシ黒斑病(Alternaria kikuchiana)、カンキツ黒点病(Diaporthe citri)等の病気に対して極めて高い防除効果を有するものである。

【0110】本発明の殺菌剤は、前記一般式(I)の新規トリアゾール誘導体を有効成分として含有するものである。

【0111】本発明の前記化合物を殺菌剤として用いる場合には、担体もしくは希釈剤、添加剤及び補助剤等と

公知の手法で混合して、通常農薬として用いられる製剤形態、例えば粉剤、粒剤、水和剤、乳剤、フロアブル剤等に調製して使用される。また他の農薬、例えば殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、植物生長調節剤等、肥料又は土壌改良剤等と混合又は併用して使用することができる。

【0112】特に他の殺菌剤と混合使用することにより、使用農薬量を減少させ、また省力化をもたらすのみならず、両薬剤の共力作用による殺菌スペクトラムの拡大及び相乗作用による一層高い効果も期待できる。

【0113】製剤に際して用いられる担体もしくは希釈剤としては、一般に農薬の製剤に使用される固体ないしは液体の担体が挙げられる。

【0114】固体担体としては、例えば、カオリナイト群、モンモリロナイト群、イライト群あるいはポリグロスカイト群等で代表されるクレイ類、詳しくはパイロフライト、アタパルジャイト、セピオライト、カオリナイト、ベントナイト、バーミキュライト、雲母やタルク等；石膏、炭酸カルシウム、ドロマイト、けいそう土、マグネシウム石灰、りん石灰、ゼオライト、無水珪酸、合成珪酸カルシウム等のその他の無機物質；大豆粉、タバコ粉、クルミ粉、小麦粉、木粉、デンプン、結晶セルロース等の植物性有機物質；クマロン樹脂、石油樹脂、アルキッド樹脂、ポリ塩化ビニル、ポリアルキレングリコール、ケトン樹脂、エステルガム、コーバルガム、ダンマルガム等の合成又は天然の高分子化合物；カルナウバロウ、蜜ロウ等のワックス類あるいは尿素等が例示できる。

【0115】適当な液体担体としては、例えば、ケロシン、鉱油、スピンデル油、ホワイトオイル等のパラフィン系又はナフテン系炭化水素；キシレン、エチルベンゼン、クメン、メチルナフタリン等の芳香族炭化水素；トリクロロエチレン、モノクロロベンゼン、オルトクロロトルエン等の塩素化炭化水素；ジオキサン、テトラヒドロフランのようなエーテル類；アセトン、メチルエチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン、アセトフェノン、イソホロン等のケトン類；酢酸エチル、酢酸アミル、エチレングリコールアセテート、ジエチレングリコールアセテート、マレイン酸ジブチル、コハク酸ジエチル等のエステル類；メタノール、n-ヘキサノール、エチレングリコール、ジエチレングリコール、シクロヘキサノール、ベンジルアルコール等のアルコール類；エチレングリコールエチルエーテル、ジエチレング

リコールブチルエーテル等のエーテルアルコール類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の極性溶媒あるいは水等が挙げられる。

【0116】その他本発明の化合物の乳化、分散、湿潤、展着、拡張、結合、崩壊性調節、有効成分安定化、流動性改良、防錆、凍結防止等の目的で、1種又は2種以上の界面活性剤及び／又はその他の補助剤を使用することもできる。

【0117】使用される界面活性剤の例としては、非イオン性、陰イオン性、陽イオン性及び両性イオン性のいずれのものをも使用しうるが、通常は非イオン性及び（又は）陰イオン性のものが使用される。

【0118】適当な非イオン性界面活性剤としては、例えば、ラウリルアルコール、ステアリルアルコール、オレイルアルコール等の高級アルコールにエチレンオキシドを重合付加させた化合物；イソオクチルフェノール、ノニルフェノール等のアルキルフェノールにエチレンオキシドを重合付加させた化合物；ブチルナフトール、オクチルナフトール等のアルキルナフトールにエチレンオキシドを重合付加させた化合物；パルミチン酸、ステアリン酸、オレイン酸等の高級脂肪酸にエチレンオキシドを重合付加させた化合物；ソレビタン等の多価アルコール高級脂肪酸エステル及びそれにエチレンオキシドを重合付加させた化合物、エチレンオキシドとプロピレンオキシドをブロック重合付加させた化合物等が挙げられる。

【0119】適当な陰イオン性界面活性剤としては、例えば、ラウリル硫酸ナトリウム、オレイルアルコール硫酸エステルアミン塩等のアルキル硫酸エステル塩、スルホコハク酸ジオクチルエステルナトリウム、2-エチルヘキセンスルホン酸ナトリウム等のアルキルスルホン酸塩、イソプロピルナフタレンスルホン酸ナトリウム、メチレンビスナフタレンスルホン酸ナトリウム、リグニンスルホン酸ナトリウム、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム等のアリールスルホン酸塩等が挙げられる。

【0120】更に、本発明の殺菌剤には、製剤の性状を改善し殺菌効果を高める目的で、カゼイン、ゼラチン、アルブミン、ニカワ、アルギン酸ソーダ、カルボキシメチルセルロース、メチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ポリビニルアルコール等の高分子化合物や他の補助剤を併用することもできる。上記担体及び種々の補助剤は製剤の剤型、適用場面等を考慮して、目的に応じてそれぞれ単独あるいは組み合わせて適宜使用される。

【0121】このようにして得られた各種製剤形における本発明化合物有効成分含有率は製剤形により種々変化するものであるが、通常0.1～99重量%が適当であり、好ましくは1～60重量%が最も適当である。

【0122】水和剤の場合は、例えば有効成分化合物を通常10～60重量%含有し、残部は固体担体及び分散

湿潤剤であって、必要に応じて保護コロイド剤、消泡剤等が加えられる。

【0123】粒剤の場合は、例えば有効成分化合物を通常1～35重量%含有し、残部は固体担体及び界面活性剤等である。有効成分化合物は固体担体と均一に混合されているか、あるいは固体担体の表面に均一に固着または吸着されており、粒の径は約0.2ないし1.5mmである。

【0124】乳剤の場合は、例えば有効成分化合物を通常5～30重量%含有しており、これに約5ないし20重量%の乳化剤が含まれ、残部は液体担体であり、必要に応じて展着剤及び防錆剤等が加えられる。

【0125】フロアブル剤の場合は、例えば有効成分化合物を通常5～50重量%含有しており、これに3ないし10重量%の分散湿潤剤が含まれ、残部は水であり必要に応じて保護コロイド剤、防腐剤、消泡剤等が加えられる。

【0126】本発明のトリアゾール誘導体は、前記一般式(I)の化合物のまま、あるいは上記の様な任意の製剤形態で剤として使用することが出来る。

【0127】本発明化合物の使用濃度又は使用量は、対象作物、使用方法、製剤形態、施用量等の違いによって異なり、一概に規定できないが、茎葉処理の場合、有効成分当たり0.1～10,000 ppm、好ましくは、1～500 ppmである。土壌処理の場合には、10～100,000 g/ha、好ましくは、200～20,000 g/haである。

【0128】

【実施例】以下に本発明の代表的な実施例を挙げるが、本発明はこれらに限定されるものではない。

【0129】製造例 1

メチル 2-〔2-〔1-ベンジル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル〕チオメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート（化合物番号 1.1）、及びメチル 2-〔2-〔2-ベンジル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル〕チオメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート（化合物番号 4.1）の製造。

【0130】(1)メチル 2-〔2-〔2-プロモメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート5.7 g、3-メルカプトトリアゾール2.0 g及び炭酸カリウム3.3 gを100 mlのアセトニトリル中で、室温下、18時間攪拌し反応させた。反応終了後、反応液を水に注ぎ、酢酸エチルを用いて抽出、乾燥、溶媒留去後、カラムクロマトグラフィーにより精製し、メチル 2-〔2-〔1, 2, 4-トリアゾール-3-イル〕チオメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレートを収量 4.3 g（収率71%）で得た。この化合物のプロトンNMRは、3.75(s, 3H); 3.83(s, 3H); 4.16(bs, 2H); 7.10-7.30(m, 4H); 7.60(s, 1H); 7.94(s, 1H)（溶媒CDCl₃、ppm）であった。

【0131】(2)メチル 2-〔2-〔1, 2, 4-トリアゾール-3-イル〕チオメチル〕フェニル-3-

メトキシアクリレート3.05g、ベンジルブロミド1.71g及び炭酸カリウム1.66gを50mlのアセトニトリル中で、加熱還流下、4時間反応させた。反応終了後、反応液を水に注ぎ、酢酸エチルを用いて抽出、乾燥、溶媒留去後、カラムクロマトグラフィーにより精製し、高極性生成物メチル 2-〔2-(1-ベンジル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)チオメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号1.1)収量1.0g(収率25%)及び低極性生成物メチル 2-〔2-(2-ベンジル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)チオメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号4.1)収量0.6g(収率15%)を得た。これらの生成物は、以下のプロトンNMRスペクトラム(溶媒CDCl₃、ppm)を示した。

【0132】化合物番号1.1

3.68(s, 3H); 3.80(s, 3H); 4.29(bs, 3H); 5.26(s, 2H); 7.10(m, 1H); 7.25(m, 4H); 7.38(m, 3H); 7.50(m, 1H); 7.57(s, 1H); 7.92(s, 1H)

化合物番号4.1

3.65(s, 3H); 3.77(s, 3H); 4.32(s, 2H); 5.08(s, 2H); 7.10(m, 3H); 7.25(m, 6H); 7.57(s, 1H); 7.91(s, 1H)

製造例2

メチル 2-〔2-(3-ベンジルチオ-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)メチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号7.1)及びメチル 2-〔2-(3-ベンジルチオ-1, 2, 4-トリアゾール-2-イル)メチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号10.1)の製造

(1) ベンジルブロミド17.1g、3-メルカプトトリアゾール10.1g及び炭酸カリウム15.2gを200mlのアセトニトリル中で、室温下、18時間攪拌し反応させた。反応終了後、反応液を水に注ぎ、酢酸エチルを用いて抽出、乾燥、溶媒留去後、カラムクロマトグラフィーにより精製し、3-ベンジルチオ-1, 2, 4-トリアゾールを収量18.1g(収率95%)で得た。この化合物のプロトンNMRは、4.36(s, 2H); 7.23-7.35(m, 5H); 8.01(s, 1H)(溶媒CDCl₃、ppm)であった。

【0133】(2) 3-ベンジルチオ-1, 2, 4-トリアゾール0.95g、メチル 2-(2-ブロモメチル)フェニル-3-メトキシアクリレート1.43g及び炭酸カリウム0.83gを30mlのアセトニトリル中で、加熱還流下、5時間反応させた。反応終了後、反応液を水に注ぎ、酢酸エチルを用いて抽出、乾燥、溶媒留去後、カラムクロマトグラフィーにより精製し、高極性生成物メチル 2-〔2-(3-ベンジルチオ-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)メチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号7.1)収量1.40g(収率71%)及び低極性生成物メチル 2-〔2-(3-ベンジルチオ-1, 2, 4-トリアゾール-2-イル)メチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号

10.1)収量0.12g(収率7%)を得た。これらの生成物は、以下のプロトンNMRスペクトラム(溶媒CDCl₃、ppm)を示した。

【0134】化合物番号7.1

3.66(s, 3H); 3.70(s, 3H); 4.33(s, 2H); 5.15(s, 2H); 7.20-7.40(m, 9H); 7.53(s, 1H); 7.76(s, 1H)

化合物番号10.1

3.64(s, 3H); 3.72(s, 3H); 4.35(s, 2H); 5.03(s, 2H); 6.98(d, 1H); 7.12(d, 1H); 7.22-7.30(m, 7H); 7.54(s, 1H); 7.89(s, 1H)

製造例3

メチル 2-〔2-(1-ベンジル-5-シクロプロピル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)チオメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号1.16)及びメチル 2-〔2-(1-ベンジル-3-シクロプロピル-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル)チオメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号4.16)の製造

(1) メチル 2-(2-ブロモメチル)フェニル-3-メトキシアクリレート5.8g及び5-シクロプロピル-3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール2.82gを、100mlのメタノール中で室温で一晩、更に還流温度で3時間反応させた。反応終了後、溶媒を留去した後、残渣に水及び酢酸エチルを加え攪拌しながら、炭酸水素ナトリウム2.5gを加え液性をアルカリ性とした。有機層を水洗後、乾燥、溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにより精製し、2-〔2-(5-シクロプロピル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)チオメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレートを収量6.6g(収率95%)で得た。この化合物のプロトンNMRは、0.98(m, 4H); 1.95(m, 1H); 3.73(s, 3H); 3.83(s, 3H); 4.13(s, 2H); 7.10(dd, 1H); 7.16-7.20(m, 3H); 7.58(s, 1H)(溶媒CDCl₃、ppm)であった。

【0135】(2) 2-〔2-(5-シクロプロピル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)チオメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート3.46g、ベンジルブロミド1.71g及び炭酸カリウム1.66gを50mlのアセトニトリル中で、加熱還流下、3時間反応させた。反応終了後、反応液を水に注ぎ、酢酸エチルを用いて抽出、乾燥、溶媒留去後、カラムクロマトグラフィーにより精製し、高極性生成物メチル 2-〔2-(1-ベンジル-5-シクロプロピル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)チオメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号1.16)収量1.9g(収率44%)及び低極性生成物メチル 2-〔2-(1-ベンジル-3-シクロプロピル-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル)チオメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号4.16)収量1.7g(収率39%)を得た。これらの生成物は、以下のプロトンNMRスペクトラム(溶媒CDCl₃、ppm)を示した。

【0136】化合物番号1.16

1.00(m, 2H); 1.08(m, 2H); 1.75(m, 1H); 3.68(s, 3H); 3.79(s, 3H); 4.24(bs, 2H); 5.33(s, 2H); 7.10(m, 1H); 7.18-7.26(m, 4H); 7.31-7.39(m, 3H); 7.50(m, 1H); 7.56(s, 1H)

化合物番号4.16

0.90-1.00(m, 4H); 2.00(m, 1H); 3.64(s, 3H); 3.75(s, 3H); 4.24(s, 2H); 4.97(s, 2H); 7.05-7.13(m, 3H); 7.21-7.30(m, 6H); 7.56(s, 1H)

製造例 4

メチル 2-〔2-(1-ベンジル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)スルフィニルメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号1.2)及びメチル 2-〔2-(1-ベンジル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)スルフォニルメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号1.3)の製造

メチル 2-〔2-(1-ベンジル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)チオメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート0.78gのジクロロメタン30ml溶液を氷冷下撹拌した中に、m-クロロ過安息香酸0.52gを加え、同温度で1時間更に室温で2時間撹拌し反応させた。反応終了後炭酸水素ナトリウム水溶液、次いで水で洗浄した後、乾燥、溶媒留去後、カラムクロマトグラフ

ィーにより精製し、低極性生成物メチル 2-〔2-(1-ベンジル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)スルフォニルメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号1.3)収量0.32g(収率38%)及び高極性生成物メチル 2-〔2-(1-ベンジル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)スルフィニルメチル〕フェニル-3-メトキシアクリレート(化合物番号1.2)収量0.35g(収率43%)を得た。これらの生成物は、以下のプロトンNMRスペクトラム(溶媒CDCl₃、ppm)を示した。

【0137】化合物番号1.2

3.69(s, 3H); 3.84(s, 3H); 4.39(d, 1H); 4.40(b, 1H); 5.36(s, 2H); 7.13-7.30(m, 6H); 7.38(m, 3H); 7.62(s, 1H); 8.09(s, 1H)

化合物番号1.3

3.67(s, 3H); 3.81(s, 3H); 4.58(b, 2H); 5.35(s, 2H); 7.13-7.50(m, 9H); 7.58(s, 1H); 7.99(s, 1H)

上記製造例1、2、3及び4と同様な手法によって製造された化合物を表2に示す。

【0138】

【表27】

2 化合物番号	NMR (ppm) 溶媒CDCl ₃
1.14	1.05(m,2H);1.17(m,2H);1.82(m,1H);3.69(s,3H);3.83(s,3H);4.35(d,1H);4.45(b,1H);5.40(s,2H);7.12-7.20(m,5H);7.25-7.38(m,4H);7.61(s,1H)
1.15	1.04(m,2H);1.13(m,2H);1.79(m,1H);3.68(s,3H);3.79(s,3H);4.54(b,2H);5.41(s,2H);7.15(m,3H);7.22(m,1H);7.33(m,4H);7.43(dd,3H);7.58(s,1H)
2.1	3.85(s,3H);4.05(s,3H);4.22(s,2H);5.24(s,2H);7.12(m,1H);7.23-7.37(m,7H);7.54(m,1H);7.90(s,1H)
2.3	3.87(s,3H);4.04(s,3H);4.50(s,2H);5.35(s,2H);7.20-7.45(m,9H);8.01(s,1H)
2.61	1.89(d,3H);3.85(s,3H);4.05(s,3H);4.22(s,2H);5.44(q,1H);7.12(m,1H);7.23-7.37(m,7H);7.53(m,1H);7.88(s,1H)
2.63	1.89(d,3H);3.86(s,3H);4.04(s,3H);4.49(s,2H);5.55(q,1H);7.20-7.72(m,9H);7.96(s,1H)
3.1	2.89(d,3H);3.96(s,3H);4.21(s,2H);5.24(s,2H);6.84(b,1H);7.15(m,1H);7.23-7.30(m,4H);7.37(m,3H);7.50(m,1H);7.90(s,1H)
3.61	1.88(d,3H);2.88(d,3H);3.96(s,3H);4.21(s,2H);5.42(q,1H);6.83(b,1H);7.15(m,1H);7.22-7.38(m,7H);7.47(m,1H);7.88(s,1H)
4.2	3.67(s,3H);3.79(s,3H);4.35(d,1H);4.60(d,1H);5.19(s,2H);6.96(d,1H);7.13-7.40(m,8H);7.61(s,1H);8.03(s,1H)
4.3	3.65(s,3H);3.81(s,3H);4.63(b,2H);5.07(b,2H);6.99(d,2H);7.13-7.28(m,7H);7.39(t,1H);7.58(s,1H);8.00(s,1H)
4.14	0.94-1.05(m,4H);2.05(m,1H);3.66(s,3H);3.77(s,3H);4.33(d,1H);4.60(d,1H);5.02(s,2H);6.98(m,1H);7.10(m,2H);7.16-7.28(m,5H);7.31-7.38(m,1H);7.59(s,1H)
4.15	0.90-1.00(m,4H);2.00(m,1H);3.65(s,3H);3.77(s,3H);4.59(s,2H);4.96(s,2H);7.00(m,1H);7.14(m,2H);7.25(m,5H);7.38(m,1H);7.54(s,1H)
5.1	3.84(s,3H);4.03(s,3H);4.27(s,2H);5.09(s,2H);7.12(m,3H);7.25-7.38(m,6H);7.89(s,1H)
5.61	1.72(d,3H);3.86(s,3H);4.03(s,3H);4.23(q,2H);5.40(q,1H);7.14-7.35(m,9H);7.91(s,1H)
6.1	2.91(d,3H);3.94(s,3H);4.25(s,2H);5.12(s,2H);6.90(b,1H);7.17(m,3H);7.25-7.35(m,6H);7.88(s,1H)
6.61	1.70(d,3H);2.93(d,3H);3.94(s,3H);4.20(q,2H);5.47(q,1H);6.93(b,1H);7.15-7.32(m,9H);7.90(s,1H)
7.2	3.69(s,3H);3.76(s,3H);4.46(q,2H);5.24(s,2H);7.14-7.40(m,9H);7.57(s,1H);7.98(s,1H)
7.3	3.68(s,3H);3.74(s,3H);4.59(s,2H);5.25(s,2H);7.15-7.53(m,9H);7.55(s,1H);7.96(s,1H)

表中 s は一重線を、d は二重線を、t は三重線を、q は四重線を、m は多重線を、b s は広い一重線を表す。

【0139】次に、本発明の化合物を用いた製剤例の実施例を示す。なお下記製剤中の「部」は重量基準である。

製剤例1 (乳剤)

化合物番号: 1.1	10部
キシレン	45部
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	7部
ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル	13部
ジメチルホルムアミド	25部

以上を均一に混合溶解して乳剤100部を得た。

【0141】

製剤例2 (水和剤)

化合物番号: 5.61	20部
ケイソウ土	70部
リグニンスルホン酸カルシウム	5部

ナフタリンスルホン酸ホルマリン縮合物 5部

以上を混合粉碎して水和剤100部を得た。 【0142】

製剤例3 (粒剤)

化合物番号: 2.3 5部

ベントナイト 50部

タルク 42部

リグニンスルホン酸ソーダ 2部

ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル 1部

以上を充分に混合した後、適量の水を加えて混練し、押 【0143】

出し造粒機を用いて造粒して粒剤100部を得た。

製剤例4 (フロアブル剤)

化合物番号: 6.1 30部

スルホコハク酸ジ-2-エチルヘキシルエステルナトリウム塩 2部

ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテル 3部

消泡剤 1部

プロピレングリコール 5部

水 59部

以上を湿式ボールミルで均一に粉碎混合し、フロアブル剤 100部を得た。

【0144】次に試験例により、本発明殺菌剤による、各種植物病防除効果を具体的に説明する。

【0145】試験例 1

(イネいもち病に対する防除試験) 水稻(品種: コシヒカリ)を直径7cmのプラスチックカップに7粒ずつ播種し、温室内で3週間育成した。製剤例1に従い乳剤化した供試薬剤を500ppmとなるように水で希釈し、イネの葉面に充分付着するように散布した。散布1日後、イネいもち病菌の孢子懸濁液を接種し、更に25℃の温室に1日保った後温室内で発病させた。接種7日後、1葉当たりの平均病斑数を調査し、無処理区と対比して下記の基準で効果を判定した。

【0146】

A: 防除価 100~95%

B: 防除価 94~80%

C: 防除価 79~60%

D: 防除価 59~ 0%

試験の結果、良好な活性を示した化合物を表3に示す。

【0147】

【表28】

表 3

化合物番号	効 果
1. 1	A
1. 16	A
4. 2	A
7. 3	A
10. 1	A

【0148】試験例 2

(イネ紋枯病に対する防除試験) 6.5cm のプラスチックカップに水稻種子6粒ずつ播種し、温室内で4~6週間育成した。第5葉が展開したイネ苗に製剤例1に従い乳剤化した供試薬剤を500ppmとなるように水で希釈し、1鉢当たり25ml散布した。風乾後、PSA培地で培養した紋枯病菌の菌糸を株元に接種し、直ちに28℃、湿度100%の温室内に入れた。接種3日後、病斑高を調査し、試験例1と同じ基準で判定を行った。試験の結果、良好な活性を示した化合物を表4に示す。

【0149】

【表29】

表 4

化合物番号	効 果
4. 1	A
7. 3	A

【0150】

【発明の効果】本発明の前記一般式(I)で表されるトリアゾール誘導体は、文献未記載の化合物である。このトリアゾール誘導体は、トリアゾールに結合した硫黄原子及びトリアゾール環の窒素原子上に2個のベンジル誘導体を置換基として有し、かつ、少なくともその一方は2位に酢酸誘導体残基を有することが特徴であり、その構造的特徴によって、このトリアゾール誘導体を含有する殺菌剤の有する優れた特性が発揮されるものと考えられる。

【0151】本発明の化合物及び殺菌剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える病害に対して顕著な殺菌効果を示し、作物に対しては害を及ぼさない。

フロントページの続き

(72)発明者 郷 敦

茨城県稲敷郡阿見町中央8-3-1 ロー
ヌ・プーラン油化アグロ株式会社阿見研究
所内

(72)発明者 沢井 伸光

茨城県稲敷郡阿見町中央8-3-1 ロー
ヌ・プーラン油化アグロ株式会社阿見研究
所内

(72)発明者 前田 貴子

茨城県稲敷郡阿見町中央8-3-1 ロー
ヌ・プーラン油化アグロ株式会社阿見研究
所内